

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関
国際事務局(43)国際公開日
2001年2月15日 (15.02.2001)

PCT

(10)国際公開番号
WO 01/10439 A1

(51) 国際特許分類⁷: A61K 31/40, 31/4025, 31/445, 31/4468, 31/4525, 31/4535, 31/454, 31/422, 31/404, 31/4155, 31/4245, 31/5377, 31/4545, 31/4709, 31/4184, 31/427, 31/506, 31/433, 31/423, 31/4192, 31/429, 31/53, A61P 37/08, 29/00, 31/18, 11/08, 43/00 // C07D 207/14, 211/56, 211/58, 211/26, 401/04, 401/06, 401/12, 401/14, 403/06, 403/12, 405/06, 405/12, 405/14, 409/12, 409/14, 413/06, 413/14, 417/06, 487/04, 495/06, 495/04, 513/04

(21)国際出願番号: PCT/JP00/05260

(22)国際出願日: 2000年8月4日 (04.08.2000)

(25)国際出願の言語: 日本語

(26)国際公開の言語: 日本語

(30)優先権データ:
特願平11/220864 1999年8月4日 (04.08.1999) JP

(71)出願人(米国を除く全ての指定国について): 帝人株式会社 (TEIJIN LIMITED) [JP/JP]; 〒541-0054 大阪府大阪市中央区南本町1丁目6番7号 Osaka (JP).

(72)発明者: および
(75)発明者/出願人(米国についてのみ): 塩田辰樹 (SHIOTA, Tatsuki) [JP/JP]; 〒191-0065 東京都日野市旭が丘4丁目3番2号 帝人株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 須藤正樹 (SUODOH, Masaki) [JP/JP]; 〒475-0837 愛知県半田市有楽町7丁目106-1 ユートピアタウン112D Aichi (JP). 横山朋典 (YOKOYAMA,

Tomonori) [JP/JP]. 室賀由美子 (MUROGA, Yumiko) [JP/JP]. 上村 幸 (KAMIMURA, Takashi) [JP/JP]. 中西顯伸 (NAKANISHI, Akinobu) [JP/JP]; 〒191-0065 東京都日野市旭が丘4丁目3番2号 帝人株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP).

(74)代理人: 前田純博 (MAEDA, Sumihiro); 〒100-0011 東京都千代田区内幸町2丁目1番1号 帝人株式会社 知的財産センター内 Tokyo (JP).

(81)指定国(国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

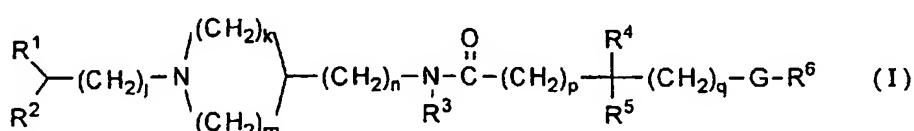
(84)指定国(広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 國際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドノート」を参照。

(54) Title: CYCLIC AMINE CCR3 ANTAGONISTS

(54)発明の名称: 環状アミンCCR3拮抗剤



WO 01/10439 A1

(57) Abstract: Drugs containing as the active ingredient cyclic amine derivatives represented by general formula (I), pharmaceutically acceptable acid addition salts thereof or pharmaceutically acceptable C₁₋₆ alkyl adducts thereof. These drugs are efficacious in preventing and treating diseases in which CCR3 participates such as asthma and allergic rhinitis.

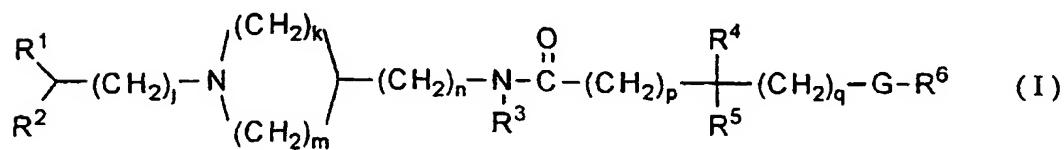
[機密有]

BEST AVAILABLE COPY



(57) 要約:

下記式 (I) で表される環状アミン誘導体、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容されるC₁—C₆アルキル付加体を有効成分として含有する医薬。喘息、アレルギー性鼻炎などのCCR3が関与する疾患を治療、予防する作用を有する。



明細書

環状アミン CCR 3 拮抗剤

5 技術分野

本発明は、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、接触皮膚炎、およびアレルギー性結膜炎などのアレルギー性疾患、潰瘍性大腸炎およびクロhn病などの炎症性腸疾患、好酸球増加症、好酸球性胃腸炎、好酸球増加性腸症、好酸球性筋膜炎、好酸球性肉芽腫、好酸球性膿疱性毛包炎、好酸球性肺炎、および好酸球性白血病など、好酸球、好塩基球、活性化T細胞などの増加、組織への浸潤が病気の進行、維持に主要な役割を演じている疾患、またはHIV（ヒト免疫不全ウイルス）の感染に起因するエイズ（AIDS：後天性免疫不全症候群）に対する治療薬および／または予防薬として効果が期待できるCCR 3 拮抗剤に関する。

15 背景技術

近年、気管支喘息などのアレルギー性疾患の本質的な病態は慢性炎症であるという概念が確立され、なかでも好酸球の炎症局所への集積がその大きな特徴の一つとしてとらえられている（例えば、Busse, W. W. J. Allergy Clin. Immunol., 1998, 102, S17-S22；藤澤隆夫、現代医療、1999, 31, 1297など参照）。例えば、サルの喘息モデルにおいて抗接着分子（ICAM-1）抗体を投与することにより、好酸球の集積が抑えられ、遅発型の喘息症状発現が抑制されることからもアレルギー性疾患における好酸球の重要性が強く示唆されている（Wegner, C. D. et al., Science, 1990, 247, 456）。

この好酸球の集積／遊走を引き起こす特異的走化因子としてエオタキシンが同定された（例えば、Jose, P. J., et al., J. Exp. Med., 1994, 179, 881；Garcia-Zepeda, E. A. et al., Nature Med., 1996, 2, 449；Ponath, P. D. et al., J. Clin. Invest., 1996, 97, 604；Kitaura, M. et al., J. Biol. Chem., 1996, 271, 7725など参照）。さらに、エオタキシンは好酸球上に発現しているCCR 3 レセプターに結合し作用を発現することが解明され、また、エオタキシン-2、RANTES (regulated upon activation normal T-cell expressed and secretedの略称)、MCP-2 (monocyte chemoattractant protein-2の略称)、MCP-3 (

monocyte chemoattractant protein-3の略称)、MCP-4 (monocyte chemoattractant protein-4の略称)などの走化性因子もエオタキシンよりも作用強度は弱いもののCCR3を介してエオタキシンと同様の作用を示し得ることが知られている(例えば、Kitaura, M. et al., J. Biol. Chem., 1996, 271, 7725; Daugherty, B. L. et al., J. Exp. Med., 1996, 183, 2349; Ponath, P. D. et al., J. Exp. Med., 1996, 183, 2437; Hiath, H. et al., J. Clin. Invest., 1997, 99, 178; Patel, V. P. et al., J. Exp. Med., 1997, 185, 1163; Forssmann, U. et al., J. Exp. Med. 185, 2171, 1997など参照)。

エオタキシンの好酸球への作用は、遊走惹起のみでなく、接着分子受容体(CD 11b)の発現増強(例えば、Tenscher, K. et al., Blood, 1996, 88, 3195など参照)、活性酸素の産生促進(例えば、Elsner, J. et al., Eur. J. Immunol., 1996, 26, 1919など参照)、EDN (eosinophil-derived neurotoxinの略称)の放出促進(El-Shazly, et al., Int. Arch. Allergy Immunol., 1998, 117 (suppl. 1), 55参照)など、好酸球の活性化に関する作用も報告されている。また、エオタキシンは骨髄からの好酸球およびその前駆細胞の血中への遊離を促進する作用を有することも報告されている(例えば、Palframan, R. T. et al., Blood, 1998, 91, 2240など参照)。

エオタキシンおよびCCR3が気管支喘息などのアレルギー性疾患において重要な役割を演じていることが、多くの報告により示されている。例えば、マウス喘息モデルにおいて抗エオタキシン抗体により好酸球浸潤が抑制されること(Gonzalo, J.-A. et al., J. Clin. Invest., 1996, 98, 2332参照)、マウス皮膚アレルギーモデルにおいて抗エオタキシン抗血清により好酸球浸潤が抑制されること(Teixeira, M. M. et al., J. Clin. Invest., 1997, 100, 1657)、マウスモデルにおいて抗エオタキシン抗体が肺肉芽腫の形成を抑制すること(Ruth, J. H. et al., J. Immunol., 1998, 161, 4276参照)、エオタキシン遺伝子欠損マウスを用いた喘息モデルおよび間質性角膜炎モデルにおいて好酸球の浸潤が抑制されること(Rothenberg, M. E. et al., J. Exp. Med., 1997, 185, 785参照)、喘息患者の気管支では健常者に比べエオタキシンおよびCCR3の発現が、遺伝子レベル、蛋白レベルともに亢進していること(Ying, S. et al., Eur. J. Immunol., 1997, 27, 3507参照)、慢性副鼻腔炎患者の鼻上皮下組織ではエオタキシンの発現が亢進していること(A. J. Respir. Cell Mol. Biol., 1997, 17, 683参照)などが報告されている。

また、炎症性大腸疾患である潰瘍性大腸炎およびクローン病の炎症部位において、エオタキシンが多く発現していることが報告されていることから (Garcia-Zepda, E. A. et al., *Nature Med.*, 1996, 2, 449参照)、これらの疾患においてもエオタキシンが重要な役割を担っていることがわかる。

5 これらのデータから、エオタキシンは、CCR3を介して好酸球を病変部位に集積、活性化することにより、好酸球が病変の進展に深く関わっていると想定され得る疾患、例えば、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、接触皮膚炎、およびアレルギー性結膜炎などのアレルギー性疾患、潰瘍性大腸炎およびクローン病などの炎症性腸疾患、好酸球増加症、好酸球性胃腸炎、好酸球増加性10 腸症、好酸球性筋膜炎、好酸球性肉芽腫、好酸球性膿疱性毛包炎、好酸球性肺炎、および好酸球性白血病などの発症、進展、維持に深く関与していることが強く示唆されている。

さらに、CCR3レセプターは好酸球のみならず好塩基球、Th2リンパ球上にも発現しており、エオタキシンによりこれらの細胞の細胞内カルシウムイオン濃度15 上昇および細胞遊走が惹起されることが報告されていることから、エオタキシンおよびCCR3は、これらの細胞を集積させ、活性化することによってもアレルギー性疾患など、これらの細胞が関与する疾患の発症、進展、維持に関わっていると考えられる (例えば、Sallusto, F. et al., *Science*, 1997, 277, 2005; Gerber, B. O. et al., *Current Biol.*, 1997, 7, 836; Sallusto, F. et al., *J. Exp. Med.* 20, 187, 875; Uguccioni, M. et al., *J. Clin. Invest.*, 1997, 100, 1137; Yamada, H. et al., *Biochem Biophys. Res. Commun.*, 1997, 231, 365など参照)。

したがって、エオタキシンのCCR3に対する結合を阻害する化合物、すなわち、CCR3拮抗剤は、エオタキシンに代表されるCCR3のリガンドの標的細胞への作用を阻害することにより、アレルギー性疾患、炎症性腸疾患などの疾患の治療薬および/または予防薬として有用であるといえるが、そのような作用を有する薬剤は現在知られてない。

また、HIV-1 (ヒト免疫不全ウイルス-1) が宿主細胞に感染する際にCCR3を利用することも報告されていることから、CCR3拮抗剤はHIVウイルス30 感染に起因するエイズ (AIDS: 後天性免疫不全症候群) の治療薬もしくは予防薬としても有用であると考えられる (例えば、et al., Choe, H. et al., *Cell*, 19

96, 85, 1135; Doranz, B. J. et al., Cell, 1996, 85, 1149参照)。

最近、キサンテンー9-カルボキサミド誘導体 (W09804554参照)、ピペラジンまたはピペリジン誘導体 (EP903349; W00029377; W00031033; W00035449; W00035451; W00035452; W00035453; W00035454; W00035876; W00035877参照)、ピロリジン誘導体 (W00031032参照)、フェニルアラニン誘導体 (W09955324; W09955330; W00004003; W00027800; W00027835; W00027843参照)、およびその他の低分子化合物 (W09802151参照) が、CCR3レセプターに対する拮抗活性を有することが報告されている。しかしながら、これらの化合物は、本発明で用いる化合物とは異なる。また、本発明で用いる化合物は、W09925686に記載されている化合物と同一のものであるが、これらの化合物がCCR3レセプターに対する拮抗活性を有することは知られていない。

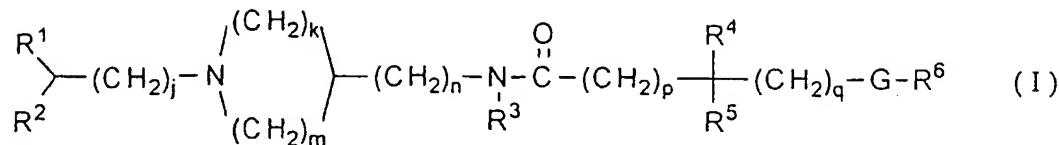
発明の開示

したがって、本発明の目的は、エオタキシンなどのCCR3のリガンドが標的細胞上のCCR3に結合することを阻害する活性を有する低分子化合物を提供することである。

本発明のさらなる目的は、CCR3拮抗剤を用いて、エオタキシンなどのCCR3のリガンドが標的細胞上のCCR3に結合することが病因の一つであるような疾患の治療法および／または予防法を提供することである。

本発明者らは、鋭意研究を重ねた結果、アリールアルキル基を有する環状アミン誘導体、その薬学的に許容し得るC₁～C₆アルキル付加体、または薬学的に許容され得る酸付加体が、エオタキシンなどのCCR3のリガンドの標的細胞に対する結合を阻害する活性を有することを発見し、さらにはこれらの化合物がCCR3が関与すると考えられる疾患の治療薬もしくは予防薬となり得ることを知見して、さらに研究を進めた結果、本発明を完成した。

すなわち、本発明によれば、下記式(I)で表される化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容されるC₁～C₆アルキル付加体を有効成分とする、CCR3拮抗作用を有する薬剤が提供される。



[式中、R¹はフェニル基、C₃～C₈シクロアルキル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基を表し、上記R¹におけるフェニル基または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成していくてもよく、さらに上記R¹におけるフェニル基、C₃～C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁～C₆アルキル基、C₃～C₈シクロアルキル基、C₂～C₆アルケニル基、C₁～C₆アルコキシ基、C₁～C₆アルキルチオ基、C₃～C₅アルキレン基、C₂～C₄アルキレンオキシ基、C₁～C₃アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、ベンジルオキシ基、ベンゾイルアミノ基、C₂～C₇アルカノイル基、C₂～C₇アルコキカルボニル基、C₂～C₇アルカノイルオキシ基、C₂～C₇アルカノイルアミノ基、C₂～C₇N～アルキルカルバモイル基、C₄～C₉N～シクロアルキルカルバモイル基、C₁～C₆アルキルスルホニル基、C₃～C₈（アルコキシカルボニル）メチル基、N～フェニルカルバモイル基、ピペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、1～ピロリジニルカルボニル基、式：-NH (C=O) O-で表される2価基、式：-NH (C=S) O-で表される2価基、アミノ基、モノ(C₁～C₆アルキル)アミノ基、もしくは、ジ(C₁～C₆アルキル)アミノ基で置換されていてもよく、これらのフェニル基、C₃～C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、C₁～C₆アルキル基、もしくはC₁～C₆アルコキシ基によって置換されていてもよい。

R²は、水素原子、C₁～C₆アルキル基、C₂～C₇アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、またはフェニル基を表し、R²におけるC₁～C₆アルキル基またはフェニル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、C₁～C₆アルキル基、もしくは

$C_1 - C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよい。ただし、 $j = 0$ のときは R^2 はヒドロキシ基ではない。

j は0-2の整数を表す。

k は0-2の整数を表す。

5 m は2-4の整数を表す。

n は0または1を表す。

R^3 は、水素原子、または（それぞれ同一または異なった任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_6$ アルキル基、もしくは $C_1 - C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよい1または2個のフェニル基）によって置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル基を表す。

10 R^4 および R^5 は、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、フェニル基、または $C_1 - C_6$ アルキル基を表し、 R^4 および R^5 における $C_1 - C_6$ アルキル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、メルカプト基、グアニジノ基、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ基、（任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、もしくはベンジルオキシ基によって置換されていてもよいフェニル基）、フェノキシ基、ベンジルオキシ基、ベンジルオキシカルボニル基、 $C_2 - C_7$ アルカノイル基、 $C_2 - C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 - C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 - C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 - C_7$ アルキルカルバモイル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ（ $C_1 - C_6$ アルキル）アミノ基、ジ（ $C_1 - C_6$ アルキル）アミノ基、もしくは（ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を1-3個有する芳香族複素環基またはそのベンゼン環との縮合により形成される縮合環）により置換されていてもよく、あるいは、 R^4 および R^5 は、いっしょになって3-6員環状炭化水素を形成していてもよい。

15 p は0または1を表す。

q は0または1を表す。

20 G は、 $-CO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-NR^7-CO-$ 、 $-CO-NR^7-$ 、 $-NH-CO-NH-$ 、 $-NH-CS-NH-$ 、 $-NR^7-SO_2-$ 、 $-SO_2-N$ 30 R^7- 、 $-NH-CO-O-$ 、または $-O-CO-NH-$ で表される基を表す。ここで、 R^7 は、水素原子または $C_1 - C_6$ アルキル基を表すか、あるいは、 R^7 は R^5 と

いっしょになって $C_2 - C_5$ アルキレン基を形成していてもよい。

R^6 は、フェニル基、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 - C_6$ シクロアルケニル基、ベンジル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を 1 - 3 個有する芳香族複素環基を表し、上記 R^6 におけるフェニル基、ベンジル基、または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を 1 - 3 個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成してもよく、さらに上記 R^6 におけるフェニル基、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 - C_6$ シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、メルカプト基、シアノ基、二トロ基、チオシアナト基、カルボキシル基、カルバモイル基、トリフルオロメチル基、 $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル基、 $C_2 - C_6$ アルケニル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_3 - C_8$ シクロアルキルオキシ基、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 - C_3$ アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルアミノ基、ベンジル基、ベンゾイル基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、

15 3 - フェニルウレイド基、 $C_2 - C_7$ アルカノイル基、 $C_2 - C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 - C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 - C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 - C_7$ N - アルキルカルバモイル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、フェニルカルバモイル基、N, N - ジ ($C_1 - C_6$ アルキル) スルファモイル基、アミノ基、モノ ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基、ジ ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基、ベンジルアミノ基、

20 $C_2 - C_7$ (アルコキシカルボニル) アミノ基、 $C_1 - C_6$ (アルキルスルホニル) アミノ基、もしくはビス ($C_1 - C_6$ アルキルスルホニル) アミノ基により置換されていてもよく、これらのフェニル基、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 - C_8$ シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、

25 $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ基、モノ ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基、またはジ ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基によって置換されていてもよい。]

さらに、本発明によれば、上記式 (I) で表される化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容される $C_1 - C_6$ アルキル付加体を有効成分とする、CCR3 が関与する疾患の治療薬もしくは予防薬が提供される。

ここに、上記式 (I) で表される化合物は、エオタキシンなどのCCR3 レセプ

ターのリガンドが標的細胞に結合することを阻害する活性、およびエオタキシンなどのCCR3のリガンドの標的細胞への生理的作用を阻害する活性を有する。すなわち、上記式(I)で表される化合物はCCR3拮抗剤である。

5 発明を実施するための最良の形態

上記式(I)において、R¹はフェニル基、C₃—C₈シクロアルキル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を1—3個有する芳香族複素環基を表し、上記R¹におけるフェニル基または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子10を1—3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成してもよく、さらに上記R¹におけるフェニル基、C₃—C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁—C₆アルキル基、C₃—C₈シクロアルキル基、C₂—C₆アルケニル基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルキルチオ基、C₃—C₅15アルキレン基、C₂—C₄アルキレンオキシ基、C₁—C₃アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、ベンジルオキシ基、ベンゾイルアミノ基、C₂—C₇アルカノイル基、C₂—C₇アルコキカルボニル基、C₂—C₇アルカノイルオキシ基、C₂—C₇アルカノイルアミノ基、C₂—C₇N—アルキルカルバモイル基、C₄—C₉N—シクロアルキルカルバモイル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、C₃—C₈(アルコキシカルボニル)メチル基、N—フェニルカルバモイル基、ピペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、1—ピロリジニルカルボニル基、式：—NH(C=O)O—で表される2価基、式：—NH(C=S)O—で表される2価基、アミノ基、モノ(C₁—C₆アルキル)アミノ基、もしくはジ(C₁—C₆アルキル)アミノ基で置換されていてもよい。

20 25 R¹における「C₃—C₈シクロアルキル基」とは、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル基などの環状のアルキル基を意味し、その好適な具体例としては、シクロプロピル基、シクロペンチル基、およびシクロヘキシル基などが挙げられる。

R¹における、「ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を1—3個有する芳香族複素環基」とは、例えば、チエニル、フリル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イ30

ソチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、トリアジニル、トリアゾリル、オキサジアゾリル（フラザニル）、チアジアゾリル基などの芳香族複素環基を意味し、その好適な具体例としては、チエニル、フリル、ピロリル、イソオキサゾリル、およびピリジル基などが挙げられる。

5 R¹における「縮合環」とは、上記フェニル基または芳香族複素環基が、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を1—3個有する芳香族複素環基と可能な任意の位置で縮合して形成される2環式芳香族複素環基を意味し、その好適な具体例としては、ナフチル、インドリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、キノリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル
10 、ベンゾトリアゾリル、ベンゾオキサジアゾリル（ベンゾフラザニル）、およびベンゾチアジアゾリル基などが挙げられる。

なかでもR¹は、フェニル基、チエニル基、ピラゾリル基、イソオキサゾリル基、ベンゾフラニル基、またはインドリル基である場合が特に好ましい。

15 R¹におけるフェニル基、C₃—C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としての「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などを意味する。

20 R¹の置換基としての「C₁—C₆アルキル基」とは、例えばメチル、エチル、n—プロピル、n—ブチル、n—ペンチル、n—ヘキシル、n—ヘプチル、n—オクチル、イソプロピル、イソブチル、sec—ブチル、tert—ブチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert—ペンチル、イソヘキシル、2—メチルペンチル、1—エチルブチル基などのC₁—C₆の直鎖または分枝状のアルキル基を意味し、その好適な具体例としては、メチル、エチル、プロピル、およびイソプロピル基などが挙げられる。

25 R¹の置換基としての「C₃—C₈シクロアルキル基」とは、前記R¹における「C₃—C₈シクロアルキル基」の定義と同様であり、その好適な具体例も同じ基を挙げることができる。

30 R¹の置換基としての「C₂—C₆アルケニル基」とは、例えば、ビニル、アリル、1—プロペニル、2—ブテニル、3—ブテニル、2—メチル—1—プロペニル、4—ペンテニル、5—ヘキセニル、4—メチル—3—ペンテニル基などのC₂—C₆の直鎖または分枝状のアルケニル基を意味し、その好適な具体例としては、ビニル基および2—メチル—1—プロペニル基などが挙げられる。

R^1 の置換基としての「 C_1-C_6 アルコキシ基」とは、前記 C_1-C_6 アルキル基とオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メトキシ基、エトキシ基などが挙げられる。

R^1 の置換基としての「 C_1-C_6 アルキルチオ基」とは、前記 C_1-C_6 アルキル基とチオ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メチルチオ基、エチルチオ基などが挙げられる。

R^1 の置換基としての「 C_3-C_5 アルキレン基」とは、例えば、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、および1-メチルトリメチレン基などの C_3-C_5 の2価のアルキレン基を意味し、その好適な具体例としては、トリメチレン基、テトラメチレン基などが挙げられる。

R^1 の置換基としての「 C_2-C_4 アルキレンオキシ基」とは、例えば、エチレンオキシ($-CH_2CH_2O-$)、トリメチレンオキシ($-CH_2CH_2CH_2O-$)、テトラメチレンオキシ($-CH_2CH_2CH_2CH_2O-$)、1, 1-ジメチルエチレンオキシ($-CH_2C(CH_3)_2O-$)基などの、 C_2-C_4 の2価アルキレン基とオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、エチレンオキシ基、トリメチレンオキシ基などが挙げられる。

R^1 の置換基としての「 C_1-C_3 アルキレンジオキシ基」とは、例えばメチレンジオキシ($-OCH_2O-$)、エチレンジオキシ($-OCH_2CH_2O-$)、トリメチレンジオキシ($-OCH_2CH_2CH_2O-$)、プロピレンジオキシ($-OCH_2CH(CH_3)O-$)基などの C_1-C_3 の2価アルキレン基と2個のオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基などが挙げられる。

R^1 の置換基としての「 C_2-C_7 アルカノイル基」とは、例えば、アセチル、プロパノイル、ブタノイル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、イソブチリル、3-メチルブタノイル、2-メチルブタノイル、ピバロイル、4-メチルペンタノイル、3, 3-ジメチルブタノイル、5-メチルヘキサノイル基などの C_2-C_7 の直鎖または分枝状のアルカノイル基を意味し、その好適な具体例としては、アセチル基などが挙げられる。

R^1 の置換基としての「 C_2-C_7 アルコキシカルボニル基」とは、前記 C_1-C_6 アルコキシ基とカルボニル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基などが挙げられる。

R^1 の置換基としての「 C_2-C_7 アルカノイルオキシ基」とは、前記 C_2-C_7 アルカノイル基とオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としてはアセチルオキシキ基などが挙げられる。

5 R^1 の置換基としての「 C_2-C_7 アルカノイルアミノ基」とは、前記 C_2-C_7 アルカノイル基とアミノ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、アセチルアミノ基などが挙げられる。

R^1 の置換基としての「 C_2-C_7 アルキルカルバモイル基」とは、前記 C_1-C_6 アルキル基とカルバモイル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、 N -メチルカルバモイル基、 N -エチルカルバモイル基などが挙げられる。

10 R^1 の置換基としての「 C_4-C_9 N -シクロアルキルカルバモイル基」とは、前記 C_3-C_8 シクロアルキル基とカルバモイル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、 N -シクロペンチルカルバモイル基、 N -シクロヘキシルカルバモイル基などが挙げられる。

15 R^1 の置換基としての「 C_1-C_6 アルキルスルホニル基」とは、前記 C_1-C_6 アルキル基とスルホニル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メチルスルホニル基などが挙げられる。

20 R^1 の置換基としての「 C_3-C_8 (アルコキシカルボニル) メチル基」とは、前記 C_2-C_7 アルコキシカルボニル基とメチル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基などが挙げられる。

R^1 の置換基としての「モノ (C_1-C_6 アルキル) アミノ基」とは、前記 C_1-C_6 アルキル基によって置換されたアミノ基を意味し、その好適な具体例としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基などが挙げられる。

25 R^1 の置換基としての「ジ (C_1-C_6 アルキル) アミノ基」とは、同一または異なる2つの前記 C_1-C_6 アルキル基によって置換されたアミノ基を意味し、その好適な具体例としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、 N -エチル- N -メチルアミノ基などが挙げられる。

30 上記の中でも、 R^1 におけるフェニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 C_1-C_6 アルキル基、 C_2-C_6 アルケニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_3-C_5 アルキレン基、 C_2-C_4 アルキレンオキシ基、メチレンジオキシ基、

フェニル基、*N*—フェニルカルバモイル基、アミノ基、およびジ(C₁—C₆アルキル)アミノ基を特に好ましい具体例として挙げることができる。特に好ましくは、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、C₁—C₆アルキル基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルキルチオ基、メチレンジオキシ基、および*N*—フェニルカルバモイル基を挙げることができる。

さらに、R¹におけるフェニル基、C₃—C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、C₁—C₆アルキル基、もしくはC₁—C₆アルコキシ基によって置換されていてもよい。ここで、ハロゲン原子、C₁—C₆アルキル基、およびC₁—C₆アルコキシ基は、前記R¹におけるフェニル基、C₃—C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、同じ基を好適な具体例として挙げることができる。

上記式(I)において、R²は、水素原子、C₁—C₆アルキル基、C₂—C₇アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、またはフェニル基を表し、R²におけるC₁—C₆アルキル基またはフェニル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、C₁—C₆アルキル基、もしくはC₁—C₆アルコキシ基によって置換されていてもよい。ただし、j=0のときは、R²はヒドロキシ基ではない。

R²におけるC₁—C₆アルキル基およびC₂—C₇アルコキシカルボニル基は、R¹におけるフェニル基、C₃—C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基についてそれぞれ定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R²におけるC₁—C₆アルキル基またはフェニル基の置換基としてのハロゲン原子、C₁—C₆アルキル基およびC₁—C₆アルコキシ基は、前記R¹におけるフェニル基、C₃—C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基または縮合環の置換基について定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げができる。

なかでもR²は、水素原子を表す場合が特に好ましい。

上記式(I)において、jは0—2の整数を表す。jは0である場合が特に好ましい。

上記式(I)において、kは0—2の整数を表し、mは2—4の整数を表す。なかでもkが0でmが3である場合の2—置換ピロリジン、kが1でmが2である場

合の3-置換ピロリジン、kが1でmが3である場合の3-置換ピペリジン、kが2でmが2である場合の4-置換ピペリジン、またはkが1でmが4である場合の3-置換ヘキサヒドロアゼピンが好ましい。特に好ましくは、kが1でmが2である場合の3-置換ピロリジンおよびkが2でmが2である場合の4-置換ピペリジンを挙げることができる。

5 上記式(I)において、nは0または1を表す。

特に、kが1でmが2でnが0である場合の3-アミドピロリジン、およびkが2でmが2でnが1である場合の4-(アミドメチル)ピペリジンを特に好ましい例として挙げることができる。

10 上記式(I)において、R³は水素原子、または(それぞれ同一または異なった任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、C₁-C₆アルキル基、もしくはC₁-C₆アルコキシ基によって置換されていてもよい1または2個のフェニル基)によって置換されていてもよいC₁-C₆アルキル基を表す。

R³におけるC₁-C₆アルキル基は、前記R¹におけるフェニル基、C₃-C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、その好適な具体例としては、メチル基、エチル基、およびプロピル基が挙げられる。

20 R³におけるC₁-C₆アルキル基の置換基としてのフェニル基の置換基としてのハロゲン原子、C₁-C₆アルキル基、およびC₁-C₆アルコキシ基は、それぞれ、前記R¹におけるフェニル基、C₃-C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

なかでも、R³は水素原子または無置換のC₁-C₆アルキル基である場合が特に好ましい。

25 上記式(I)において、R⁴およびR⁵は、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、フェニル基、またはC₁-C₆アルキル基を表し、R⁴およびR⁵におけるC₁-C₆アルキル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、メルカプト基、グアニジノ基、C₃-C₈シクロアルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、(任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、C₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、もしくはベンジルオキシ基によって置換されていてもよいフェニル基)、フェノキシ基、

ベンジルオキシ基、ベンジルオキシカルボニル基、 C_2-C_7 アルカノイル基、 C_2-C_7 アルコキシカルボニル基、 C_2-C_7 アルカノイルオキシ基、 C_2-C_7 アルカノイルアミノ基、 C_2-C_7 *N*-アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ(C_1-C_6 アルキル)アミノ基、ジ(C_1-C_6 アルキル)アミノ基、または(ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/もしくは窒素原子を1-3個有する芳香族複素環基またはそのベンゼン環との縮合により形成される縮合環)により置換されていてもよく、あるいは、 R^4 および R^5 は、いっしょになつて3-6員環状炭化水素を形成していくてもよい。

R^4 および R^5 における C_1-C_6 アルキル基は、前記 R^1 におけるフェニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R^4 および R^5 における C_1-C_6 アルキル基の置換基としてのハロゲン原子、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_2-C_7 アルカノイル基、 C_2-C_7 アルコキシカルボニル基、 C_2-C_7 アルカノイルオキシ基、 C_2-C_7 アルカノイルアミノ基、 C_2-C_7 *N*-アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ(C_1-C_6 アルキル)アミノ基、およびジ(C_1-C_6 アルキル)アミノ基は、前記 R^1 におけるフェニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R^4 および R^5 における C_1-C_6 アルキル基の置換基としての C_3-C_8 シクロアルキル基、および、ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/もしくは窒素原子を1-3個有する芳香族複素環基は、前記 R^1 において定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R^4 および R^5 における C_1-C_6 アルキル基の置換基としてのフェニル基の置換基としてのハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、および C_1-C_6 アルコキシ基は、前記 R^1 においてフェニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R^4 、 R^5 およびその隣接炭素原子とからなる「3-6員環状炭化水素」の好適な具体例としては、シクロプロパン、シクロブタン、シクロペンタン、およびシクロヘキサンなどが挙げられる。なかでも、水素原子と C_1-C_6 アルキル基を、 R^4 と R

⁵の特に好ましい例として挙げることができる。

上記式（I）において、pは0または1を表し、qは0または1を表す。pとqがともに0である場合が特に好ましい。

上記式（I）において、Gは、-CO-、-SO₂-、-CO-O-、-NR⁷-
 5 CO-、-CO-NR⁷-、-NH-CO-NH-、-NH-CS-NH-、-NR⁷-SO₂-、-SO₂-NR⁷-、-NH-CO-O-、または-O-CO-NH-で表される基を表す。ここで、R⁷は、水素原子またはC₁-C₆アルキル基を表すか、あるいは、R⁷はR⁵といっしょになってC₂-C₅アルキレン基を形成していくてもよい。

10 ここで、-CO-はカルボニル基を、-SO₂-はスルホニル基を、-CS-はチオカルボニル基をそれぞれ意味する。Gの特に好ましい例としては、例えば-NR⁷-CO-および-NH-CO-NH-で表される基などが挙げられる。

15 R⁷におけるC₁-C₆アルキル基は、前記R¹におけるフェニル基、C₃-C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

20 R⁵とR⁷とからなる「C₂-C₅アルキレン基」とは、例えば、メチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、テトラメチレン、1-メチルトリメチレン、ペンタメチレンなどのC₂-C₅の直鎖または分枝状アルキレン基を意味し、その好適な具体例としてはエチレン、トリメチレン、テトラメチレン基などが挙げられる。な
 かでもR⁷としては、水素原子を特に好ましい例として挙げることができる。

25 上記式（I）において、R⁶はフェニル基、C₃-C₈シクロアルキル基、C₃-C₆シクロアルケニル基、ベンジル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を1-3個有する芳香族複素環基を表し、上記R⁶におけるフェニル基、ベンジル基、または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を1-3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成していくてもよく、さらに上記R⁶におけるフェニル基、C₃-C₈シクロアルキル基、C₃-C₆シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、チオシアナト基、カルボキシル基、カルバモイル基、トリフルオロメチル基、C₁-C₆アルキル基、C₃-C₈シクロアルキル基、C₂-C₆アルケニル基、C₁-C₆アルコキシ基、C₃-C₈シクロアルキルオキシ基、C₁

—C₆アルキルチオ基、C₁—C₃アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルアミノ基、ベンジル基、ベンゾイル基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、3—フェニルウレイド基、C₂—C₇アルカノイル基、C₂—C₇アルコキシカルボニル基、C₂—C₇アルカノイルオキシ基、C₂—C₇アルカノイルアミノ基、C₂—C₇N—アルキルカルバモイル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、フェニルカルバモイル基、N, N—ジ(C₁—C₆アルキル)スルファモイル基、アミノ基、モノ(C₁—C₆アルキル)アミノ基、ジ(C₁—C₆アルキル)アミノ基、ベンジルアミノ基、C₂—C₇(アルコキシカルボニル)アミノ基、C₁—C₆(アルキルスルホニル)アミノ基、もしくはビス(C₁—C₆アルキルスルホニル)アミノ基により置換されていてもよい。

R⁶におけるC₃—C₈シクロアルキル基、ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を1—3個有する芳香族複素環基、および、縮合環は、前記R¹に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R⁶における「C₃—C₈シクロアルケニル基」とは、例えば、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、およびシクロオクテニル基など環状アルケニル基を意味し、その好適な具体例としては、1—シクロペンテニル基、1—シクロヘキセニル基などが挙げられる。なかでも、R⁶としては、フェニル基、フリル基、チエニル基、インドリル基、ベンゾフラザニル基を特に好ましい例として挙げることができる。

R⁶におけるフェニル基、C₃—C₈シクロアルキル基、C₃—C₈シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としてのハロゲン原子、C₁—C₆アルキル基、C₂—C₆アルケニル基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルキルチオ基、C₁—C₃アルキレンジオキシ基、C₂—C₇アルカノイル基、C₂—C₇アルコキシカルボニル基、C₂—C₇アルカノイルオキシ基、C₂—C₇アルカノイルアミノ基、C₂—C₇N—アルキルカルバモイル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、モノ(C₁—C₆アルキル)アミノ基、およびジ(C₁—C₆アルキル)アミノ基は、前記R¹におけるフェニル基、C₃—C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R⁶の置換基としてのC₃—C₈シクロアルキル基は、前記R¹におけるC₃—C₈シ

クロアルキル基に関して定義されたものと同様であり、同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R^6 の置換基としての「 C_3-C_8 シクロアルキルオキシ基」とは、前記 C_3-C_8 シクロアルキル基とオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、
5 シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基などを挙げることができる。

R^6 の置換基としての「 N, N -ジ(C_1-C_6 アルキル)スルファモイル基」とは、同一または異なった2つの前記 C_1-C_6 アルキル基によって置換されたスルファモイル基を意味し、その好適な具体例としては、例えば N, N -ジメチルスルファモイル基、 N, N -ジエチルスルファモイル基、 N -エチル- N -メチルスルファモイル基などが挙げられる。
10

R^6 の置換基としての「 C_2-C_7 (アルコキシカルボニル)アミノ基」とは、前記 C_2-C_7 アルコキシカルボニル基とアミノ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、例えばメトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基
15などを挙げることができる。

R^6 の置換基としての「 C_1-C_6 (アルキルスルホニル)アミノ基」とは、前記 C_1-C_6 アルキルスルホニル基とアミノ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、(メチルスルホニル)アミノ基などを挙げることができる。

R^6 の置換基としての「ビス(C_1-C_6 アルキルスルホニル)アミノ基」とは、同一または異なった2つの前記 C_1-C_6 アルキルスルホニル基によって置換されたアミノ基を意味し、その好適な具体例としては、ビス(メチルスルホニル)アミノ基などを挙げることができる。
20

なかでも、 R^6 におけるフェニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、 C_3-C_8 シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としては、
25 ハロゲン原子、メルカプト基、ニトロ基、トリフルオロメチル基、 C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、フェニル基、ベンジルオキシ基、フェニルスルフィニル基、 C_2-C_7 アルカノイル基、 C_2-C_7 アルカノイルアミノ基、アミノ基などを好ましい例として挙げることができる。特に好ましくは、ハロゲン原子、ニトロ基、トリフルオロメチル基、 C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、フェニルスルフィニル基、およびアミノ基を挙げることができる。
30

さらに、 R^6 におけるフェニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、 C_3-C_8 シクロ

アルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、 C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、モノ(C_1-C_6 アルキル)アミノ基、またはジ(C_1-C_6 アルキル)アミノ基によって置換されていてもよい。

R^6 におけるフェニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、 C_3-C_8 シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基の置換基としてのハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、モノ(C_1-C_6 アルキル)アミノ基、およびジ(C_1-C_6 アルキル)アミノ基は、前記 R^1 におけるフェニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

上記式(I)で表される化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容される C_1-C_6 アルキル付加体は、その治療有効量を製薬学的に許容される担体および/または希釈剤とともに医薬組成物とすることによって、本発明のエオタキシンなどのCCR3のリガンドが標的細胞上のCCR3に結合することを阻害する医薬、あるいはエオタキシンなどのCCR3のリガンドの標的細胞への生理的作用を阻害する作用をもつ医薬、さらにはCCR3が関与すると考えられる疾患の治療薬もしくは予防薬とすることができます。すなわち上記式(I)で表される環状アミン誘導体、その薬学的に許容される酸付加塩体、またはその薬学的に許容される C_1-C_6 アルキル付加体は、経口的に、あるいは、静脈内、皮下、筋肉内、経皮、または直腸内など非経口的に投与することができる。

経口投与の剤形としては、例えば錠剤、丸剤、顆粒剤、散剤、液剤、懸濁剤、カプセル剤などが挙げられる。

錠剤の形態にするには、例えば乳糖、デンプン、結晶セルロースなどの賦形剤；カルボキシメチルセルロース、メチルセルロース、ポリビニルピロリドンなどの結合剤；アルギン酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、ラウリル硫酸ナトリウムなどの崩壊剤などを用いて通常の方法により成形することができる。

丸剤、散剤、顆粒剤も同様に前記の賦形剤などを用いて通常の方法によって成形することができる。液剤、懸濁剤は、例えばトリカプリリン、トリアセチンなどのグリセリンエステル類、エタノールなどのアルコール類などを用いて通常の方法に

よって成形される。カプセル剤は、顆粒剤、散剤、あるいは液剤などをゼラチンなどのカプセルに充填することによって成形される。

皮下、筋肉内、静脈内投与の剤型としては、水性あるいは非水性溶液剤などの形態にある注射剤がある。水性溶液剤は、例えば生理食塩水などが用いられる。非水性溶液剤は、例えばプロピレングリコール、ポリエチレングリコール、オリーブ油、オレイン酸エチルなどが用いられ、これらに必要に応じて防腐剤、安定剤などが添加される。注射剤は、バクテリア保留フィルターを通す濾過、殺菌剤の配合の処置を適宜行うことによって無菌化される。

経皮投与の剤型としては、例えば軟膏剤、クリーム剤などが挙げられ、軟膏剤は10、ヒマシ油、オリーブ油などの油脂類、またはワセリンなどを用いて、クリーム剤は、脂肪油、またはジエチレングリコールやソルビタンモノ脂肪酸エステルなどの乳化剤を用いて通常の方法によって成形される。

直腸内投与のためには、ゼラチンソフトカプセルなどの通常の座剤が用いられる。

本発明の環状アミン誘導体、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容されるC₁—C₆アルキル付加体の投与量は、疾患の種類、投与経路、患者の年齢や性別、および疾患の程度などによって異なるが、通常成人一人当たり1—15 500 mg/日である。

上記式(I)の環状アミン誘導体の好適な具体例として、以下のTable 1.

1—1. 221に示される各置換基を含有する化合物を挙げることができる。

Table 1. 1—1. 221において、「chirality」は「絶対配置」、すなわち環状アミンの環上の不斉炭素の絶対配置を意味する。「R」は、環状アミンの環上の不斉炭素原子がRの絶対配置をもつこと、「S」は、不斉炭素原子がSの絶対配置をもつこと、「—」はラセミ体であるか、あるいはその化合物が環状アミン上において不斉炭素原子をもたないことを意味する。

Table 1.1

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{CH}_2-(\text{CH}_2)_l-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-$
2	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3-$
3	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{N}-$
4	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3-$
5	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3-$
6	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3-$
7	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{Br}-$
8	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{F}-$
9	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{Cl}-$
10	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_3-$
11	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_3-$

Table 1.2

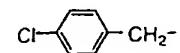
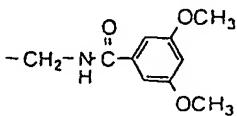
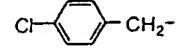
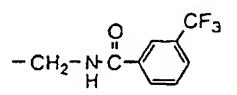
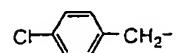
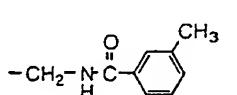
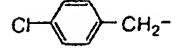
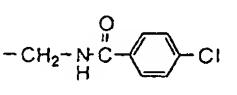
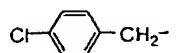
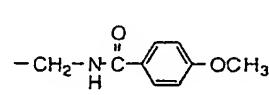
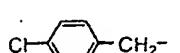
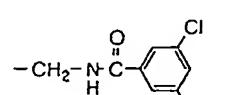
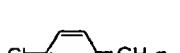
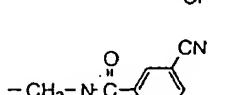
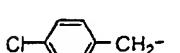
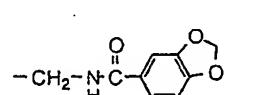
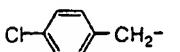
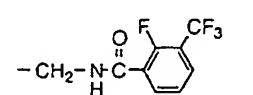
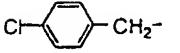
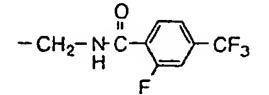
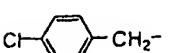
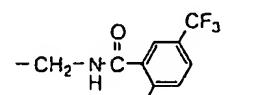
Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4 R^5	R^6			
	$-(\text{CH}_2)_p$	$-(\text{CH}_2)_q$	G				
12		1	2	0	S	H	
13		1	2	0	S	H	
14		1	2	0	S	H	
15		1	2	0	S	H	
16		1	2	0	S	H	
17		1	2	0	S	H	
18		1	2	0	S	H	
19		1	2	0	S	H	
20		1	2	0	S	H	
21		1	2	0	S	H	
22		1	2	0	S	H	

Table 1.3

Compd. No.	R^1 R^2 C_2H_5	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^4 R^5 $-(\text{CH}_2)_q$ G-R^6
23	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{CF}_3)-$
24	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{OCF}_3)-$
25	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{CF}_3)-$
26	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{O}_2\text{N})-$
27	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{NO}_2)-$
28	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{NO}_2)-$
29	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{CF}_3)-$
30	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-$
31	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{Br})-$
32	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{F})-$
33	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{Cl})-$

Table 1.4

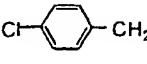
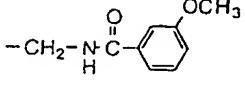
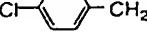
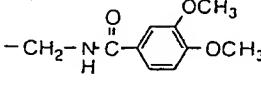
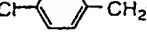
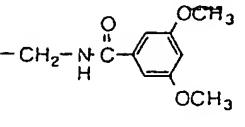
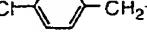
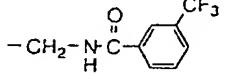
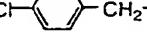
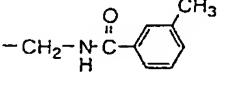
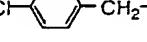
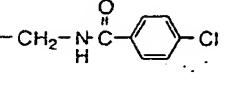
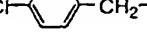
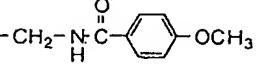
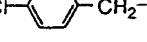
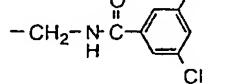
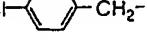
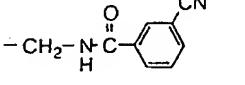
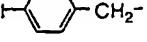
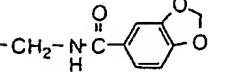
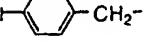
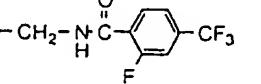
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
34		1	2	0	R	H	
35		1	2	0	R	H	
36		1	2	0	R	H	
37		1	2	0	R	H	
38		1	2	0	R	H	
39		1	2	0	R	H	
40		1	2	0	R	H	
41		1	2	0	R	H	
42		1	2	0	R	H	
43		1	2	0	R	H	
44		1	2	0	R	H	

Table 1.5

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \diagup - (CH_2)_l - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
45	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{F}_3)\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3$
46	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{F}_3)\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3$
47	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{F}_3)\text{C}(=\text{O})\text{OCF}_3$
48	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{F}_3)\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3$
49	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{F}_3)\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3$
50	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{F}_3)\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3$
51	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{F}_3)\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3$
52	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{F}_3)\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3$
53	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{F}_3)\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3$
54	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{F}_3)\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3$
55	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{F}_3)\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3$

Table 1.6

Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4 R^5	R^6	
	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$		$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{G}-\text{R}^6$	
56	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1 2 0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$ H_3C
57	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1 2 0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$ H_3C
58	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1 2 0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{Cl}$
59	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1 2 0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{Br}$
60	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1 2 0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$
61	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1 2 0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{F}_5$
62	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1 2 0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
63	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1 2 0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2\text{CH}_3$
64	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1 2 0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CN}$
65	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1 2 0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{H}_5$
66	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1 2 0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{H}_3$

Table 1.7

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---} (CH_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
67	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{H} \end{array} \text{C} \text{---} \begin{array}{c} \text{F} \\ \\ \text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2 \end{array}$
68	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{H} \end{array} \text{C} \text{---} \begin{array}{c} \text{F} \\ \\ \text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2 \end{array}$
69	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{H} \end{array} \text{C} \text{---} \begin{array}{c} \text{F} \\ \\ \text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2 \end{array}$
70	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{H} \end{array} \text{C} \text{---} \begin{array}{c} \text{F} \\ \\ \text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2 \end{array}$
71	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{H} \end{array} \text{C} \text{---} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_3\text{OCH}_3 \\ \\ \text{H}_3\text{CO} \end{array}$
72	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{H} \end{array} \text{C} \text{---} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_3\text{OCF}_3 \end{array}$
73	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{H} \end{array} \text{C} \text{---} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_3\text{OC(=O)F}_3 \end{array}$
74	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{H} \end{array} \text{C} \text{---} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_3\text{CO}_2\text{CH}_3 \end{array}$
75	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{H} \end{array} \text{C} \text{---} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2 \\ \\ \text{F}_3\text{C} \end{array}$
76	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{H} \end{array} \text{C} \text{---} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_3\text{F} \\ \\ \text{F}_3\text{C} \end{array}$
77	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{H} \end{array} \text{C} \text{---} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_3\text{F} \\ \\ \text{F}_2\text{C} \end{array}$

Table 1.8

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \text{---} (CH_2)_i \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
78	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(F)cc1})\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(F)cc1}$
79	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(C(F)(F)F)cc1})\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(C(F)(F)F)cc1}$
80	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(C(F)(F)F)cc1})\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(C(F)(F)F)cc1}$
81	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(CC)c1})\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(CC)c1}$
82	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	-	$-\text{CH}_3$	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(CC)c1})\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(CC)c1}$
83	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc([N+](=O)[O-])cc1})\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc([N+](=O)[O-])cc1}$
84	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc([N+](=O)[O-])cc1})\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc([N+](=O)[O-])cc1}$
85	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	-	H	$-(CH_2)_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(CC)c1})\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(CC)c1}$
86	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	-	H	$-(CH_2)_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc([N+](=O)[O-])cc1})\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc([N+](=O)[O-])cc1}$
87	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(C(F)(F)F)cc1})\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(C(F)(F)F)cc1}$
88	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(C(F)(F)F)cc1})\text{---C}(=\text{O})\text{---c1ccc(C(F)(F)F)cc1}$

Table 1.9

Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4	R^5	R^6		
	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$		$-(\text{CH}_2)_p$	$-(\text{CH}_2)_q$	$\text{G}-\text{R}^6$		
89	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Br}$
90	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F}$
91	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
92	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
93	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
94	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
95	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
96	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
97	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
98	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
99	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$

Table 1.10

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 > (CH_2)_l \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
100	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-(CH2)2Nc1ccccc1C(=O)Nc2ccccc2C#N</chem>
101	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-(CH2)2Nc1ccccc1C(=O)c2ccccc2OC</chem>
102	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-(CH2)2Nc1ccccc1C(=O)c2ccccc2C(F)(F)F</chem>
103	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-(CH2)2Nc1ccccc1C(=O)c2ccccc2C(F)(F)C(F)(F)F</chem>
104	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-(CH2)2Nc1ccccc1C(=O)c2ccccc2C(F)(F)C(F)(F)F</chem>
105	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-(CH2)2Nc1ccccc1C(=O)c2ccccc2C(F)(F)C(F)(F)C(F)(F)F</chem>
106	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-(CH2)2Nc1ccccc1C(=O)c2ccccc2OC(F)(F)F</chem>
107	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-(CH2)2Nc1ccccc1C(=O)c2ccccc2F</chem>
108	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-(CH2)2Nc1ccccc1C(=O)c2ccccc2NO2</chem>
109	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-(CH2)2Nc1ccccc1C(=O)c2ccccc2NO2</chem>
110	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-(CH2)2Nc1ccccc1C(=O)c2ccccc2N(C)(C)O</chem>

Table 1.11

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2-(CH_2)_j- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q-G-R^6$
111	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-C(=O)c1ccc(C(F)(F)F)cc1$
112	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-C(=O)c1ccc(F)cc1$
113	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-C(=O)c1ccc(Br)cc1$
114	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-C(=O)c1ccc(F)cc1$
115	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-C(=O)c1ccc(Cl)cc1$
116	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-C(=O)c1ccc(OCH3)cc1$
117	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-C(=O)c1ccc(OCH3)cc1$
118	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-C(=O)c1ccc(OCH3)cc1$
119	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-C(=O)c1ccc(C(F)(F)F)cc1$
120	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-C(=O)c1ccc(C)cc1$
121	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-C(=O)c1ccc(Cl)cc1$

Table 1.12

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{CH}_2-\text{C}(\text{R}^1)(\text{R}^2)-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
122	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
123	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2$
124	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CN})$
125	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})_2$
126	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_2(\text{CF}_3)_2$
127	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_2(\text{CF}_3)_2$
128	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_2(\text{F})(\text{CF}_3)_2$
129	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_2(\text{F})(\text{CF}_3)_2$
130	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_2(\text{OCF}_3)_2$
131	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_2(\text{F})(\text{CF}_3)_2$
132	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_2(\text{O}_2\text{N})_2$

Table 1.13

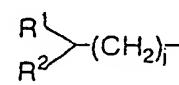
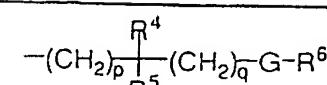
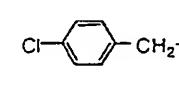
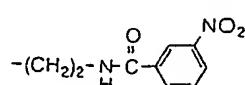
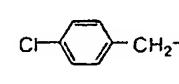
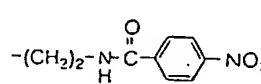
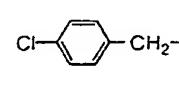
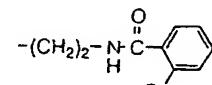
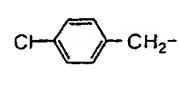
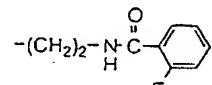
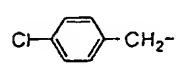
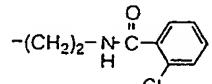
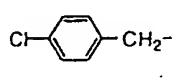
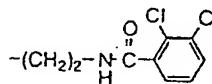
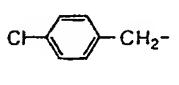
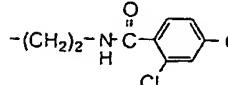
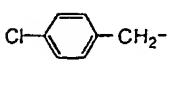
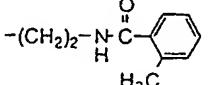
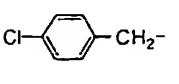
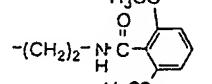
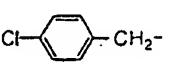
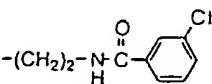
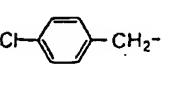
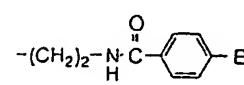
Compd. No.		k	m	n	chirality	R ³	
133		1	2	0	R	H	
134		1	2	0	R	H	
135		1	2	0	R	H	
136		1	2	0	R	H	
137		1	2	0	R	H	
138		1	2	0	R	H	
139		1	2	0	R	H	
140		1	2	0	R	H	
141		1	2	0	R	H	
142		1	2	0	R	H	
143		1	2	0	R	H	

Table 1.14

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{CH}_2-\text{C}(\text{R}^1)(\text{R}^2)-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
144	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{H}_4-$
145	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
146	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
147	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2\text{CH}_3$
148	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CN}$
149	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_1\text{H}_8$
150	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_1\text{H}_8$
151	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F}$
152	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F}$
153	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F}$
154	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F}$

Table 1.15

Compd. No.	R^1 R^2	$-(\text{CH}_2)_l-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^4 R^5 $-(\text{CH}_2)_q-$ $\text{G}-\text{R}^6$
155	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	$-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})^{\text{+}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)\text{F}_3\text{C}$
156	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	$-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})^{\text{+}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCF}_3)\text{F}_3\text{C}$
157	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	$-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})^{\text{+}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCOCF}_3)\text{F}_3\text{C}$
158	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	$-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})^{\text{+}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCOC(=O)CH}_3)\text{F}_3\text{C}$
159	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	$-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})^{\text{+}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})\text{F}_3\text{C}$
160	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	$-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})^{\text{+}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F}_2\text{C})\text{F}_3\text{C}$
161	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	$-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})^{\text{+}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F}_2\text{C}_2\text{F})\text{F}_3\text{C}$
162	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	$-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})^{\text{+}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F}_2\text{C}_2\text{F}_2)\text{F}_3\text{C}$
163	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	$-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})^{\text{+}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)\text{F}_3\text{C}$
164	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	$-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})^{\text{+}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{F}_3\text{C}$
165	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	$-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})^{\text{+}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2\text{F}_3\text{C}$

Table 1.16

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 > (CH_2)_l^- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
166		1	2	0	R	H	
167		1	2	0	R	H	
168		1	2	0	R	H	
169		1	2	0	R	H	
170		1	2	0	R	H	
171		1	2	0	R	H	
172		1	2	0	R	H	
173		1	2	0	R	H	
174		1	2	0	R	H	
175		1	2	0	R	H	
176		1	2	0	R	H	

Table 1.17

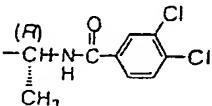
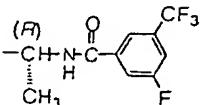
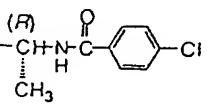
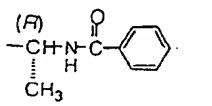
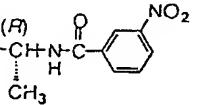
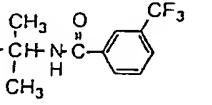
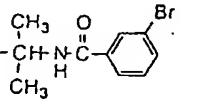
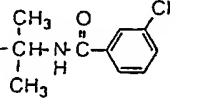
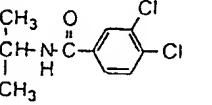
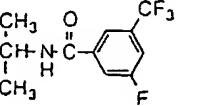
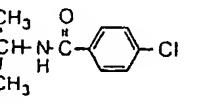
Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2-(CH_2)_l- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ CH-N-C(=O)- \end{array} (CH_2)_q-G-R^6$
177	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	
178	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	
179	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	
180	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	
181	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	
182	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	
183	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	
184	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	
185	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	
186	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	
187	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	

Table 1.18

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \text{---} (CH_2)_l \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
188	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
189	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
190	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
191	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
192	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
193	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
194	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
195	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
196	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
197	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
198	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	

Table 1.19

Compd. No.	R^1 R^2	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^5	R^4	$-(\text{CH}_2)_q$ $\text{G}-\text{R}^6$
199		$(\text{CH}_2)_j$	1	2	0	R	H			
200		$(\text{CH}_2)_j$	1	2	0	R	H			
201		$(\text{CH}_2)_j$	1	2	0	R	H			
202		$(\text{CH}_2)_j$	1	2	0	R	H			
203		$(\text{CH}_2)_j$	1	2	0	R	H			
204		$(\text{CH}_2)_j$	1	2	0	R	H			
205		$(\text{CH}_2)_j$	1	2	0	R	H			
206		$(\text{CH}_2)_j$	1	2	0	R	H			
207		$(\text{CH}_2)_j$	1	2	0	R	H			
208		$(\text{CH}_2)_j$	1	2	0	R	H			
209		$(\text{CH}_2)_j$	1	2	0	R	H			

Table 1.20

Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4 R^5	R^6			
	$\text{--}(\text{CH}_2)_k\text{--}$	$\text{--}(\text{CH}_2)_m\text{--}$	$\text{--}(\text{CH}_2)_n\text{--}$	chirality	$\text{--}(\text{CH}_2)_p\text{--}$	$\text{--}(\text{CH}_2)_q\text{--}$	G--R^6
210	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	
211	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	
212	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	
213	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	
214	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	-	H	$\text{--}(\text{CH}_2)_3\text{--C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_5$
215	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	-	H	$\text{--}(\text{CH}_2)_3\text{--C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--OCH}_3$
216	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	-	H	$\text{--}(\text{CH}_2)_3\text{--C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--S}$
217	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	-	H	$\text{--}(\text{CH}_2)_2\text{--C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--OCH}_3$
218	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	-	H	$\text{--}(\text{CH}_2)_2\text{--C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_3$
219	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	-	H	$\text{--}(\text{CH}_2)_2\text{--C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--OCH}_3$
220	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	-	H	$\text{--}(\text{CH}_2)_2\text{--C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_5$

Table 1.21

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \text{---} (CH_2)_j \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
221	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-(CH_2)_2 \text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} \text{---} \text{C}_6\text{H}_5$
222	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-(CH_2)_2 \text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} \text{---} \text{C}_6\text{H}_5 \text{---} \text{Cl}$
223	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-(CH_2)_2 \text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} \text{---} \text{C}_6\text{H}_5 \text{---} \text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$
224	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \end{array} \text{---} \text{C}_6\text{H}_5 \text{---} \text{CH}_3$
225	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-(CH_2)_3 \text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_5$
226	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-(CH_2)_3 \text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{OCH}_3$
227	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-(CH_2)_3 \text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{Cl}$
228	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-(CH_2)_3 \text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{OCH}_3$
229	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{C} \end{array} \text{---} \text{CH}_2 \text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_5 \text{---} \text{CH}_3$
230	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \\ \text{C}_5\text{H}_9 \end{array} \text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_5 \text{---} \text{F}$
231	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-(CH_2)_3 \text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_5 \text{---} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} \text{---} \text{CH}_3$

Table 1.22

Compd. No.	R^1 R^2 - $\text{C}(\text{CH}_2)_j-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-$ $\text{C}(\text{R}^4, \text{R}^5)-$ $(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
232	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-$ <chem>c1ccccc1</chem>
233	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{CH}_2-$ <chem>c1ccccc1</chem>
234	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-$ <chem>c1ccncc1</chem>
235	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-$ <chem>c1ccccc1Cl</chem>
236	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{S}(=\text{O})-$ <chem>c1ccc2c(c1)N(C)C2</chem>
237	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2-$ <chem>c1ccccc1</chem>
238	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-$ <chem>c1ccccc1Cl</chem>
239	<chem>c1ccccc1CH2-</chem>	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ <chem>c1ccccc1(C(F)(F)F)F</chem>
240	<chem>FC(F)c1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ <chem>c1ccccc1(C(F)(F)F)F</chem>
241	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ <chem>c1ccccc1(C(F)(F)F)F</chem>
242	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ <chem>c1ccccc1(C(F)(F)F)F</chem>

Table 1.23

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_m\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
243		1	2	0	S	H	
244		1	2	0	S	H	
245		1	2	0	S	H	
246		1	2	0	S	H	
247		1	2	0	S	H	
248		1	2	0	S	H	
249		1	2	0	S	H	
250		1	2	0	S	H	
251		1	2	0	S	H	
252		1	2	0	S	H	
253		1	2	0	S	H	

Table 1.2.4

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
254		1	2	0	S	H	
255		1	2	0	S	H	
256		1	2	0	S	H	
257		1	2	0	S	H	
258		1	2	0	S	H	
259		1	2	0	S	H	
260		1	2	0	S	H	
261		1	2	0	S	H	
262		1	2	0	S	H	
263		1	2	0	S	H	
264		1	2	0	S	H	

Table 1.25

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}(\text{CH}_2)_j^-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
265		1	2	0	S	H	
266		1	2	0	S	H	
267		1	2	0	S	H	
268		1	2	0	S	H	
269		1	2	0	S	H	
270		1	2	0	S	H	
271		1	2	0	S	H	
272		1	2	0	S	H	
273		1	2	0	S	H	
274		1	2	0	S	H	
275		1	2	0	S	H	

Table 1.2.6

Compd. No.	R^1 R^2	$(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}$ $-(CH_2)_q$	$G-R^6$
276		$-CH_2-$	1	2	0	S	H		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
277		$-CH_2-$	1	2	0	S	H		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
278	$\text{H}_3\text{CO}_2\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$-CH_2-$	1	2	0	S	H		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
279	$\text{F}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$-CH_2-$	1	2	0	S	H		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
280	$\text{F}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$-CH_2-$	1	2	0	S	H		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
281	$\text{HO}_2\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$-CH_2-$	1	2	0	S	H		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
282	$(\text{H}_3\text{C})_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$-CH_2-$	1	2	0	S	H		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
283		$-CH_2-$	1	2	0	S	H		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
284		$-CH_2-$	1	2	0	S	H		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
285		$-CH_2-$	1	2	0	R	H		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
286		$-CH_2-$	1	2	0	R	H		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$

Table 1.27

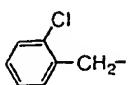
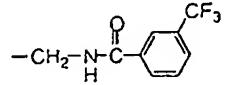
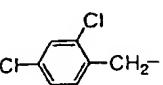
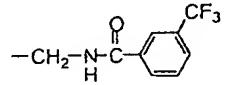
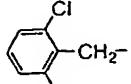
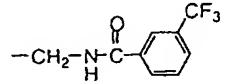
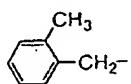
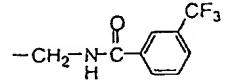
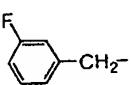
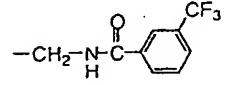
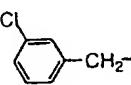
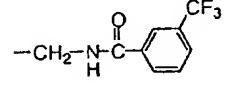
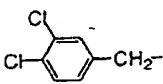
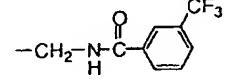
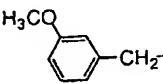
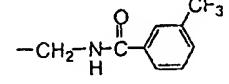
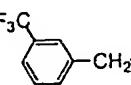
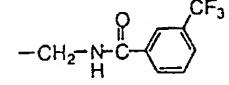
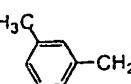
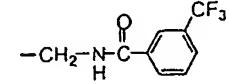
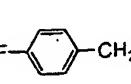
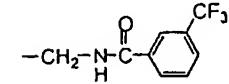
Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \text{---} (CH_2)_l \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \text{---} \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} \text{---} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
287		1	2	0	R	H	
288		1	2	0	R	H	
289		1	2	0	R	H	
290		1	2	0	R	H	
291		1	2	0	R	H	
292		1	2	0	R	H	
293		1	2	0	R	H	
294		1	2	0	R	H	
295		1	2	0	R	H	
296		1	2	0	R	H	
297		1	2	0	R	H	

Table 1.28

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
298	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>
299	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>
300	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>
301	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>
302	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>
303	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>
304	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>
305	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>
306	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>
307	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>
308	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(C(=O)N(C)c1ccc(C(F)(F)F)cc1)Cc2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>

Table 1.29

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{--}(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{--}(\text{CH}_2)_q$ G--R^6
309		1	2	0	R	H	
310		1	2	0	R	H	
311		1	2	0	R	H	
312		1	2	0	R	H	
313		1	2	0	R	H	
314		1	2	0	R	H	
315		1	2	0	R	H	
316		1	2	0	R	H	
317		1	2	0	R	H	
318		1	2	0	R	H	
319		1	2	0	R	H	

Table 1.30

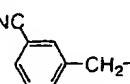
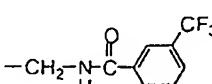
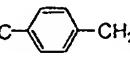
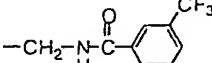
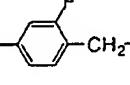
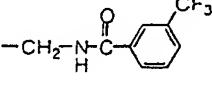
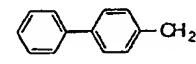
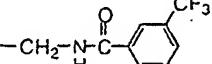
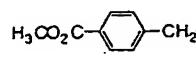
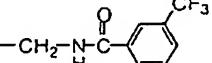
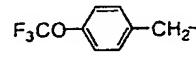
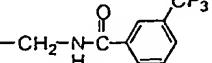
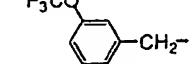
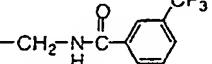
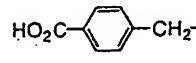
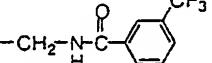
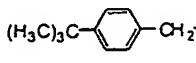
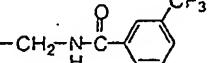
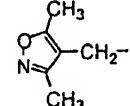
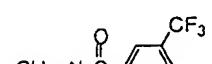
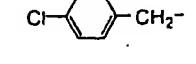
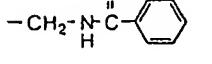
Compd. No.	R^1 R^2	$\geq (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$	$\begin{array}{c} R^4 \\ \\ -(CH_2)_q \\ \\ R^5 \end{array}$	$G-R^6$
320		$\geq (CH_2)_l$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
321		$\geq (CH_2)_l$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
322		$\geq (CH_2)_l$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
323		$\geq (CH_2)_l$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
324		$\geq (CH_2)_l$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
325		$\geq (CH_2)_l$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
326		$\geq (CH_2)_l$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
327		$\geq (CH_2)_l$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
328		$\geq (CH_2)_l$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
329		$\geq (CH_2)_l$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
330		$\geq (CH_2)_l$	0	3	1	-	H	$-(CH_2)_p$		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$

Table 1.3.1

Compd. No.	R^1 $\text{R}^2>(\text{CH}_2)_j-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
331		0	3	1	-	H	
332		0	3	1	-	H	
333		0	3	1	-	H	
334		0	3	1	-	H	
335		0	3	1	-	H	
336		0	3	1	-	H	
337		0	3	1	-	H	
338		0	3	1	-	H	
339		0	3	1	R	H	
340		0	3	1	S	H	
341		0	3	1	-	H	

Table 1.3.2

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \\ \diagdown \end{array} - (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
342		0	3	1	-	H	
343		0	3	1	-	H	
344		0	3	1	-	H	
345		0	3	1	-	H	
346		0	3	1	-	H	
347		0	3	1	-	H	
348		0	3	1	-	H	
349		0	3	1	-	H	
350		0	3	1	-	H	
351		0	3	1	-	H	
352		0	3	1	-	H	

Table 1.33

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} (CH_2)_j \begin{array}{c} \diagdown \\ \diagup \end{array} \begin{array}{c} R^4 \\ \diagup \\ R^5 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
353		1	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{-N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})\text{-C}_6\text{H}_4$
354		1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2\text{-N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})\text{-C}_6\text{H}_4$
355		1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2\text{-N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})\text{-C}_6\text{H}_4\text{-CH}_3$
356		1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2\text{-N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})\text{-C}_6\text{H}_4\text{-C}_5\text{H}_5\text{N}$
357		1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2\text{-N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})\text{-C}_6\text{H}_4\text{-CH}_3$
358		1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2\text{-N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})\text{-C}_6\text{H}_4\text{-CF}_3$
359		1	3	0	-	H	$-(CH_2)_2\text{-N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})\text{-C}_6\text{H}_4$
360		1	3	0	-	H	$-(CH_2)_2\text{-N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})\text{-C}_6\text{H}_4\text{-NO}_2$
361		1	3	0	-	H	$-(CH_2)_3\text{-C}(=\text{O})\text{-C}_6\text{H}_4$
362		1	3	0	-	H	$-(CH_2)_3\text{-C}(=\text{O})\text{-C}_6\text{H}_4\text{-OCH}_3$
363		1	3	0	-	H	$-(CH_2)_3\text{-C}(=\text{O})\text{-C}_6\text{H}_4\text{-S}$

Table 1.3.4

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{G}-\text{R}^6$
364	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)_2-$
365	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2-$
366	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)_2-\text{F}$
367	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
368	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
369	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
370	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$
371	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{S}(\text{O})-\text{CH}_3$
372	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{S}(\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
373	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}_H-\text{C}_6\text{H}_5$
374	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}_H-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)_2$

Table 1.3.5

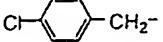
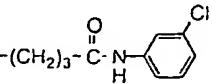
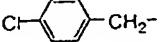
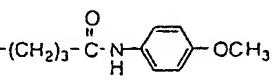
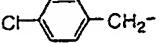
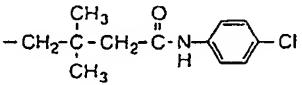
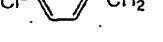
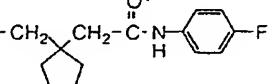
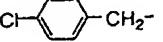
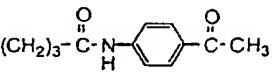
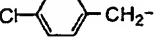
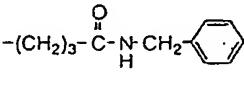
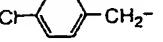
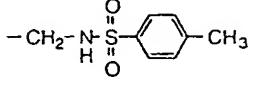
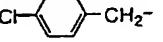
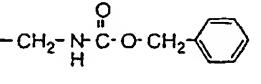
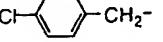
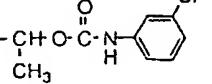
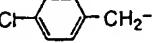
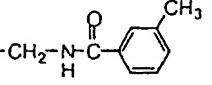
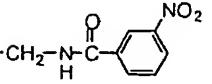
Compd. No.	R^1 R^2 R^3	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^4 R^5 $-(\text{CH}_2)_q$ G R^6
375		1	3	0	-	H	
376		1	3	0	-	H	
377		1	3	0	-	H	
378		1	3	0	-	H	
379		1	3	0	-	H	
380		1	3	0	-	H	
381		1	3	0	-	H	
382		1	3	0	-	H	
383		1	3	0	-	H	
384		2	2	0	-	H	
385		2	2	0	-	H	

Table 1.36

Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4 R^5	R^6			
	$\text{---}(\text{CH}_2)_p\text{---}$	k	$\text{---}(\text{CH}_2)_p\text{---}$	$\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}$			
	$\text{---}(\text{CH}_2)_m\text{---}$	m	$\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}$	$\text{---}(\text{CH}_2)_n\text{---}$			
386		2	2	0	-	H	
387		2	2	0	-	H	
388		2	2	0	-	H	
389		2	2	0	-	H	
390		2	2	0	-	H	
391		2	2	0	-	H	
392		2	2	0	-	H	
393		2	2	0	-	H	
394		2	2	0	-	H	
395		2	2	0	-	H	
396		2	2	0	-	H	

Table 1.37

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagdown \\ R^2 \\ \diagup \\ -\text{(\text{CH}_2)}_i-\end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-\text{(\text{CH}_2)}_p-\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \\ \\ -\text{(\text{CH}_2)}_q-\text{G}-\text{R}^6\end{array}$
397		2	2	0	-	H	
398		2	2	0	-	H	
399		2	2	0	-	H	
400		2	2	0	-	H	
401		2	2	0	-	H	
402		2	2	0	-	H	
403		2	2	0	-	H	
404		2	2	0	-	H	
405		2	2	0	-	H	
406		2	2	0	-	H	
407		2	2	0	-	H	

Table 1.3.8

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_l -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \diagup \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
408		2	2	0	-	H	
409		2	2	0	-	H	
410		2	2	0	-	H	
411		2	2	0	-	H	
412		2	2	0	-	H	
413		2	2	0	-	H	
414		2	2	0	-	H	
415		2	2	0	-	H	
416		2	2	0	-	H	
417		2	2	0	-	H	
418		2	2	0	-	H	

Table 1.39

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---G---R}^6$
419.		2	2	0	-	H	
420		2	2	0	-	H	
421		2	2	0	-	H	
422		2	2	0	-	H	
423		2	2	0	-	H	
424		2	2	0	-	H	
425		2	2	0	-	H	
426		2	2	0	-	H	
427		2	2	0	-	H	
428		2	2	0	-	H	
429		2	2	0	-	H	

Table 1.40

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-(CH_2)_l- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}(CH_2)_q-G-R^6$
430		2	2	0	-	H	
431		2	2	0	-	H	
432		2	2	0	-	H	
433		2	2	0	-	H	
434		1	3	1	-	H	
435		1	3	1	-	H	
436		1	3	1	-	H	
437		1	3	1	-	H	
438		1	3	1	-	H	
439		1	3	1	-	H	
440		1	3	1	-	H	

Table 1.4.1

Compd. No.	R^1 R^2 — $(\text{CH}_2)_j$ —	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ — $\begin{array}{c} \text{R}^4 \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{R}^5 \end{array}$ — $(\text{CH}_2)_q$ —G—R ⁶
441	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(Br)cc1</chem>
442	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(Cl)cc1</chem>
443	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(Br)cc1</chem>
444	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC(F)=CC(F)=C3</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(F)cc1</chem>
445	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC(Cl)=CC(Cl)=C3</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(Cl)cc1</chem>
446	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(C)cc1</chem>
447	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc2ccccc2c1</chem>
448	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC(=NO2)C=C4</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc2ccccc2c1</chem>
449	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC(=O)C(=O)C=C4</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc2ccccc2c1</chem>
450	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC(F)(F)C=C4</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc2ccccc2c1</chem>
451	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC(F)=CC(F)=C3</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc2ccccc2c1</chem>

Table 1.4.2

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \text{---} \text{C} \text{---} (\text{CH}_2)_l \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ \text{C} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G} \text{---} R^6 \\ \\ R^5 \end{array}$
452	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)N(c1ccc(Cl)cc1)C(F)(F)F</chem>
453	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)N(c1ccc(Cl)cc1)Br</chem>
454	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)N(c1ccc(Cl)cc1)Cl</chem>
455	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)N(c1ccc(Cl)cc1)Br</chem>
456	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)N(c1ccc(Cl)cc1)F</chem>
457	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	1	3	1	-	H	<chem>CC(=O)N(c1ccc(Cl)cc1)Cl</chem>
458	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)N(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>
459	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)N(c1ccc(Cl)cc1)C(C)C</chem>
460	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)N(c1ccc(Cl)cc1)C(C)C</chem>
461	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)N(c1ccc(Cl)cc1)C(F)(F)F</chem>
462	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)N(c1ccc(Cl)cc1)C(C)C</chem>

Table 1.4.3

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_l -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ -C(=O)- \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
463		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$
464		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)_2-\text{CH}_2-$
465		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{N}-$
466		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{NO}_2-$
467		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{Br}-$
468		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{N}(\text{CH}_3)_2-$
469		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{OCH}_3-$
470		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{CN}-$
471		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{CO}_2\text{CH}_3-$
472		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-$
473		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3-$

Table 1.44

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{C}(=\text{O})\text{R}^4$ R^5 $-(\text{CH}_2)_q\text{G}-\text{R}^6$
474	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H}-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3$
475	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H}-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
476	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H}-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{NO}_2$
477	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H}-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$
478	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H}-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{C}_3\text{H}_5\text{N}$
479	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H}-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{O}$
480	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H}-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{OBr}$
481	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H}-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{S}$
482	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H}-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{SCH}_3$
483	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H}-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{SCH}_3$
484	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H}-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{N}$

Table 1.45

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
485		2	2	1	-	H	
486		2	2	1	-	H	
487		2	2	1	-	H	
488		2	2	1	-	H	
489		2	2	1	-	H	
490		2	2	1	-	H	
491		2	2	1	-	H	
492		2	2	1	-	H	
493		2	2	1	-	H	
494		2	2	1	-	H	
495		2	2	1	-	H	

Table 1.46

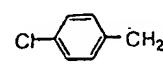
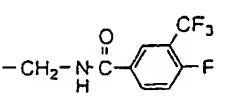
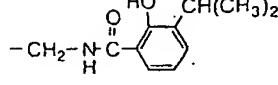
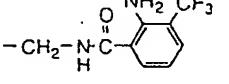
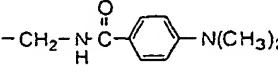
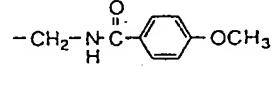
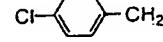
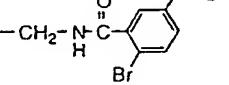
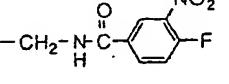
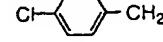
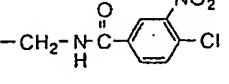
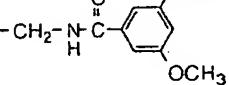
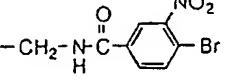
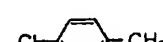
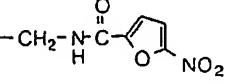
Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \end{array} \geq (CH_2)_l -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
496		2	2	1	-	H	
497		2	2	1	-	H	
498		2	2	1	-	H	
499		2	2	1	-	H	
500		2	2	1	-	H	
501		2	2	1	-	H	
502		2	2	1	-	H	
503		2	2	1	-	H	
504		2	2	1	-	H	
505		2	2	1	-	H	
506		2	2	1	-	H	

Table 1.47

Compd. No.	R^1 R^2	$(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^4 R^5 $(\text{CH}_2)_q$ G-R ⁶
507		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H	
508		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H	
509		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H	
510		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H	
511		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H	
512		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H	
513		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H	
514		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H	
515		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H	
516		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H	
517		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H	

Table 1.4.8

Compd. No.	R^1 R^2	$(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^4 R^5 $(\text{CH}_2)_q$	$\text{G}-\text{R}^6$
518		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H		
519		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H		
520		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	$-\text{CH}_3$		
521		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH-}$ 		
522		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	$-\text{CH}_2\text{CH-}$ 		
523		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH-}$ 		
524		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	$-\text{CH}_2\text{CH-}$ 		
525		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H		
526		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H		
527		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H		
528		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H		

Table 1.49

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\substack{R^4 \\ \\ R^5}}{\underset{\substack{ \\ }}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
529		2	2	1	-	H	
530		2	2	1	-	H	
531		2	2	1	-	H	
532		2	2	1	-	H	
533		2	2	1	-	H	
534		2	2	1	-	H	
535		2	2	1	-	H	
536		2	2	1	-	H	
537		2	2	1	-	H	
538		2	2	1	-	H	
539		2	2	1	-	H	

Table 1.50

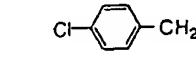
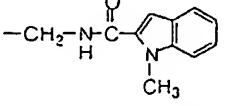
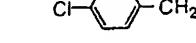
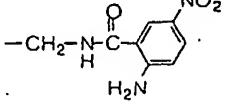
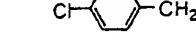
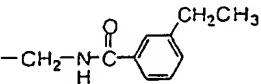
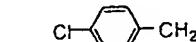
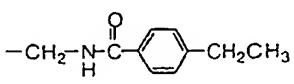
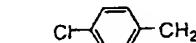
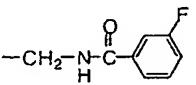
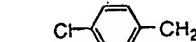
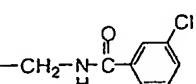
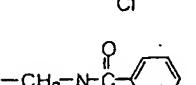
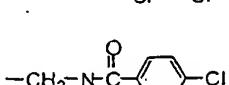
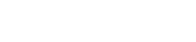
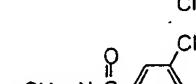
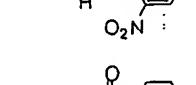
Compd. No.	R^1 R^2	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p \text{R}^4 \text{R}^5 \text{R}^6 \text{G}-\text{R}^7$
540		2	2	1	-	H	
541		2	2	1	-	H	
542		2	2	1	-	H	
543		2	2	1	-	H	
544		2	2	1	-	H	
545		2	2	1	-	H	
546		2	2	1	-	H	
547		2	2	1	-	H	
548		2	2	1	-	H	
549		2	2	1	-	H	
550		2	2	1	-	H	

Table 1.5.1

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
551	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
552	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
553	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
554	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}_H-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F}$
555	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}_H-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
556	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}_H-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
557	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4$
558	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
559	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
560	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CN}$
561	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Br}$

Table 1.52

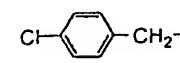
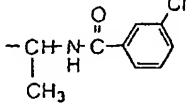
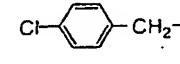
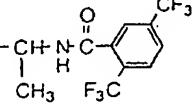
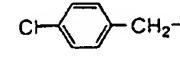
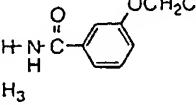
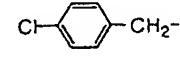
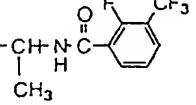
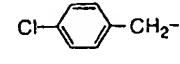
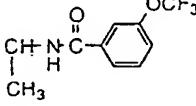
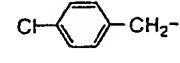
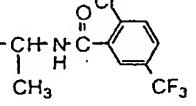
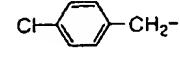
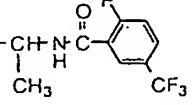
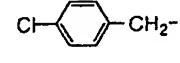
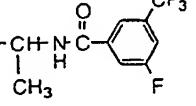
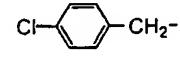
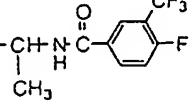
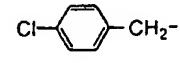
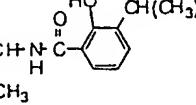
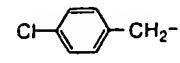
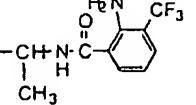
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
562		2	2	1	-	H	
563		2	2	1	-	H	
564		2	2	1	-	H	
565		2	2	1	-	H	
566		2	2	1	-	H	
567		2	2	1	-	H	
568		2	2	1	-	H	
569		2	2	1	-	H	
570		2	2	1	-	H	
571		2	2	1	-	H	
572		2	2	1	-	H	

Table 1.53

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---} (CH_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \overset{\substack{R^4 \\ \\ R^5}}{\underset{\substack{ \\ }}{\text{---}}} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
573	$\text{Cl---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---} \overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{Br}$
574	$\text{Cl---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---} \overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{Br}$
575	$\text{Cl---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---} \overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{C}(\text{CH}_3)_3$
576	$\text{Cl---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---} \overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{SCH}_3$
577	$\text{Cl---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---} \overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{H}_3\text{C}$
578	$\text{Cl---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---} \overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{S---} \text{C}_6\text{H}_5$
579	$\text{Cl---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---} \overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{N---} \text{C}_6\text{H}_5$
580	$\text{Cl---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---} \overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_3$
581	$\text{Cl---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---} \overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{S---} \text{C}_6\text{H}_5$
582	$\text{Cl---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---} \overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{H}_3\text{C}$
583	$\text{Cl---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---} \overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{N---} \text{C}_6\text{H}_5$

Table 1.54

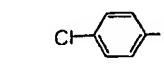
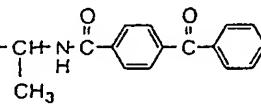
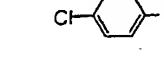
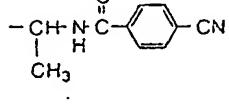
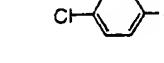
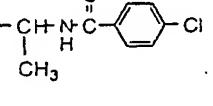
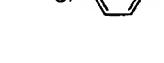
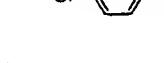
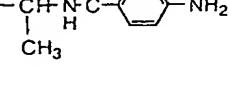
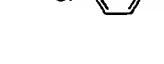
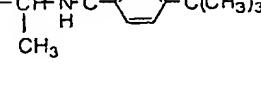
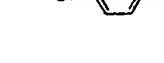
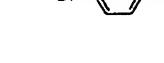
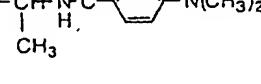
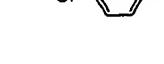
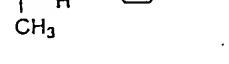
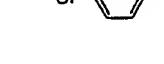
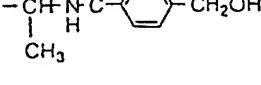
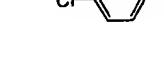
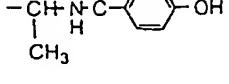
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}\text{R}^6$
584		2	2	1	-	H	
585		2	2	1	-	H	
586		2	2	1	-	H	
587		2	2	1	-	H	
588		2	2	1	-	H	
589		2	2	1	-	H	
590		2	2	1	-	H	
591		2	2	1	-	H	
592		2	2	1	-	H	
593		2	2	1	-	H	
594		2	2	1	-	H	

Table 1.55

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \text{---} (CH_2)_l \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
595		2	2	1	-	H	
596		2	2	1	-	H	
597		2	2	1	-	H	
598		2	2	1	-	H	
599		2	2	1	-	H	
600		2	2	1	-	H	
601		2	2	1	-	H	
602		2	2	1	-	H	
603		2	2	1	-	H	
604		2	2	1	-	H	
605		2	2	1	-	H	

Table 1.56

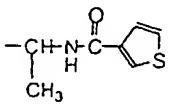
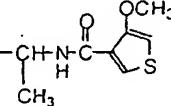
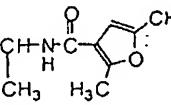
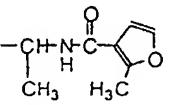
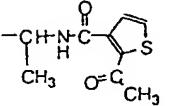
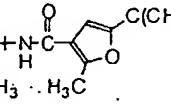
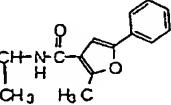
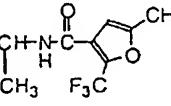
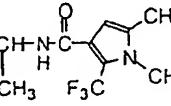
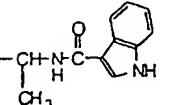
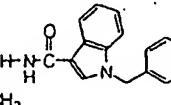
Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-(CH_2)_j- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}(CH_2)_q-G-R^6$
606	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
607	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
608	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
609	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
610	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
611	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
612	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
613	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
614	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
615	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
616	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	

Table 1.57

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\substack{R^4 \\ \\ R^5}}{\underset{\substack{ \\ \\ \\ }}{\text{C}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
617	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{---}\overset{\substack{\text{H} \\ \\ \text{H}}}{\text{C}}\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CF}_3$
618	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{---}\overset{\substack{\text{H} \\ \\ \text{H}}}{\text{C}}\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}$
619	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{---}\overset{\substack{\text{H} \\ \\ \text{H}}}{\text{C}}\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CN}$
620	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{---}\overset{\substack{\text{H} \\ \\ \text{H}}}{\text{C}}\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{Br}$
621	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{---}\overset{\substack{\text{H} \\ \\ \text{H}}}{\text{C}}\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{Cl}$
622	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{---}\overset{\substack{\text{H} \\ \\ \text{H}}}{\text{C}}\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{N}(\text{CH}_3)_2$
623	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{---}\overset{\substack{\text{H} \\ \\ \text{H}}}{\text{C}}\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{OCH}_3$
624	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{---}\overset{\substack{\text{H} \\ \\ \text{H}}}{\text{C}}\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{NO}_2$
625	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{---}\overset{\substack{\text{H} \\ \\ \text{H}}}{\text{C}}\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---NH}_2$
626	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{---}\overset{\substack{\text{H} \\ \\ \text{H}}}{\text{C}}\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
627	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{---}\overset{\substack{\text{H} \\ \\ \text{H}}}{\text{C}}\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ }}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---OCH}_2\text{CH}_3$

Table 1.58

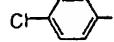
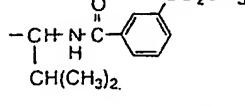
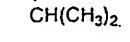
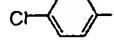
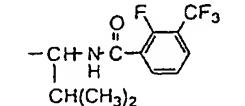
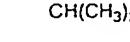
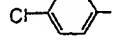
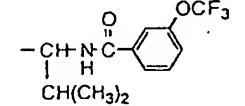
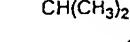
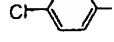
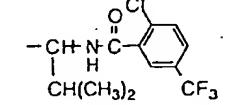
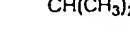
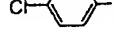
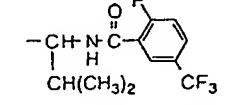
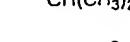
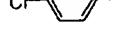
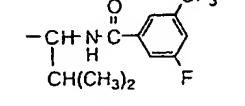
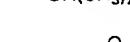
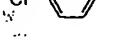
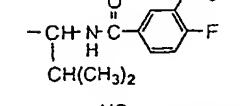
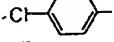
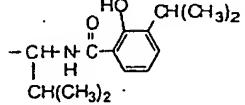
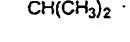
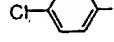
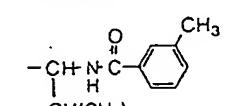
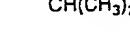
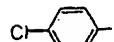
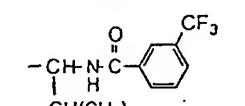
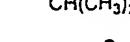
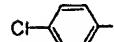
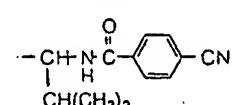
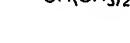
Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2-(CH_2)_l- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
628		2	2	1	-	H	 
629		2	2	1	-	H	 
630		2	2	1	-	H	 
631		2	2	1	-	H	 
632		2	2	1	-	H	 
633		2	2	1	-	H	 
634		2	2	1	-	H	 
635		2	2	1	-	H	 
636		2	2	1	-	H	 
637		2	2	1	-	H	 
638		2	2	1	-	H	 

Table 1.5.9

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{C}(\text{R}^4)\text{R}^5(\text{CH}_2)_q\text{G}-\text{R}^6$
639	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{CH}_3)_2$
640	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
641	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{CO}_2\text{CH}_3$
642	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4$
643	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
644	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(\text{CH}_3)_3$
645	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{NH}_2$
646	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2\text{OH}$
647	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$
648	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
649	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$

Table 1.60

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-(CH_2)_j- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
650	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
651	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
652	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
653	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
654	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
655	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
656	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
657	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
658	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
659	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
660	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	2	2	1	-	H	

Table 1.6.1

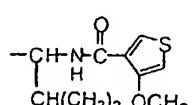
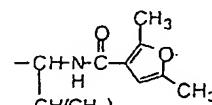
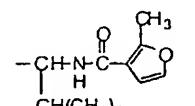
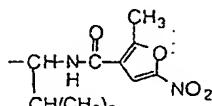
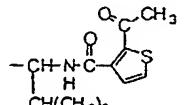
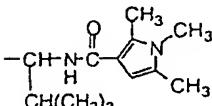
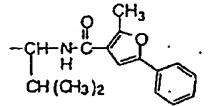
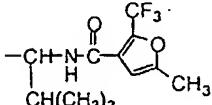
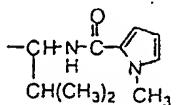
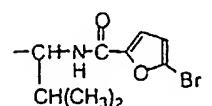
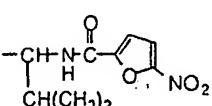
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
661	$\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
662	$\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
663	$\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
664	$\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
665	$\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
666	$\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
667	$\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
668	$\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
669	$\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
670	$\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
671	$\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	

Table 1.62

Compd. No.	R^1 R^2	$(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ R^4 R^5 $(CH_2)_q$ G-R ⁶
672	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	
673	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	
674	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	
675	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	
676	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	
677	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	
678	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	
679	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	
680	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	
681	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	
682	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	

Table 1.63

Compd. No.	R^1 R^2	$(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	R^4 R^5	$-(CH_2)_p$ $-(CH_2)_q$ $G-R^6$
683	Cl-	CH_2-	2	2	1	-	H		
684	Cl-	CH_2-	2	2	1	-	H		
685	Cl-	CH_2-	2	2	1	-	H		
686	Cl-	CH_2-	2	2	1	-	H		
687	Cl-	CH_2-	2	2	1	-	H		
688	Cl-	CH_2-	2	2	1	-	H		
689	Cl-	CH_2-	2	2	1	-	H		
690	Cl-	CH_2-	2	2	1	-	H		
691	Cl-	CH_2-	2	2	1	-	H		
692	Cl-	CH_2-	2	2	1	-	H		
693	Cl-	CH_2-	2	2	1	-	H		

Table 1.64

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
694	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
695	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
696	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
697	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
698	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
699	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
700	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
701	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
702	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
703	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
704	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	

Table 1.6.5

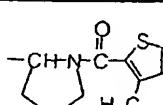
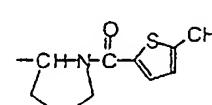
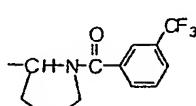
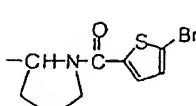
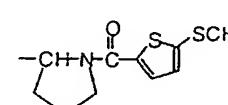
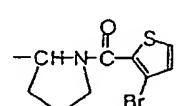
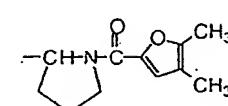
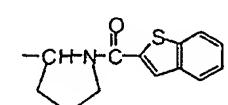
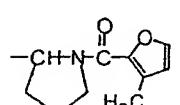
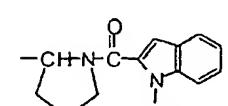
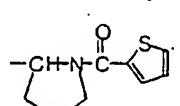
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{C}(\text{R}^4)\text{R}^5(\text{CH}_2)_q\text{G}-\text{R}^6$
705	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
706	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
707	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
708	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
709	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
710	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
711	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
712	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
713	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
714	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
715	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	

Table 1.66

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^4 R^5 $-(\text{CH}_2)_q$ G---R^6
716		2	2	1	-	H	
717		2	2	1	-	H	
718		2	2	1	-	H	
719		2	2	1	-	H	
720		2	2	1	-	H	
721		2	2	1	-	H	
722		2	2	1	-	H	
723		2	2	1	-	H	
724		2	2	1	-	H	
725		2	2	1	-	H	
726		2	2	1	-	H	

Table 1.67

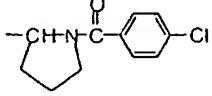
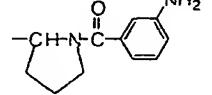
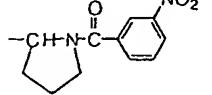
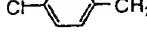
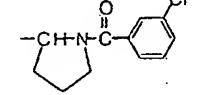
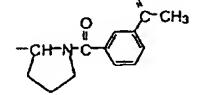
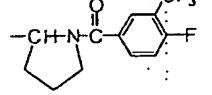
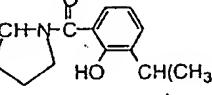
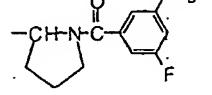
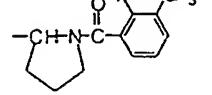
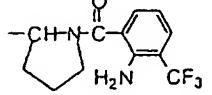
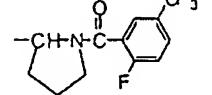
Compd. No.	R^1 $\text{---} (CH_2)_j \text{---}$ R^2	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \text{---} \begin{array}{c} R^4 \\ \\ -C(=O)- \end{array} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
727		2	2	1	-	H	
728		2	2	1	-	H	
729		2	2	1	-	H	
730		2	2	1	-	H	
731		2	2	1	-	H	
732		2	2	1	-	H	
733		2	2	1	-	H	
734		2	2	1	-	H	
735		2	2	1	-	H	
736		2	2	1	-	H	
737		2	2	1	-	H	

Table 1.6.8

Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4 R^5	R^6		
	$\text{CH}_2\text{--}(\text{CH}_2)_j\text{--}$	k	m	n	chirality	$-(\text{CH}_2)_p\text{--}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q\text{--}\text{G--}\text{R}^6$
738		2	2	1	-	
739		2	2	1	-	
740		2	2	1	-	
741		2	2	1	-	
742		2	2	1	-	
743		2	2	1	-	
744		2	2	1	-	
745		2	2	1	-	
746		2	2	1	-	
747		2	2	1	-	
748		2	2	1	-	

Table 1.69

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \searrow \swarrow \\ \diagup \quad \diagdown \\ (CH_2)_l \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
749		2	2	1	-	H	
750		2	2	1	-	H	
751		2	2	1	-	H	
752		2	2	1	-	H	
753		2	2	1	-	H	
754		2	2	1	-	H	
755		2	2	1	-	H	
756		2	2	1	-	H	
757		2	2	1	-	H	
758		2	2	1	-	H	
759		2	2	1	-	H	

Table 1.70

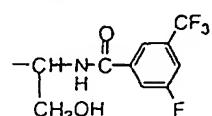
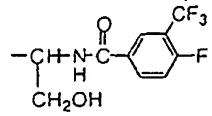
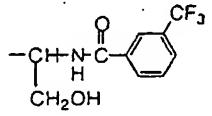
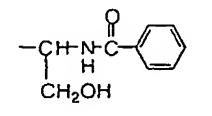
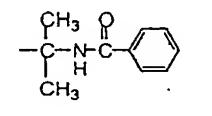
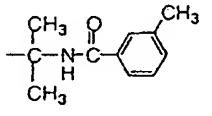
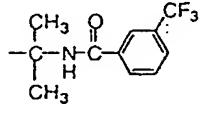
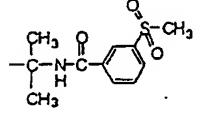
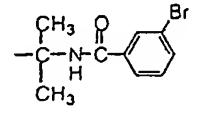
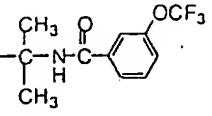
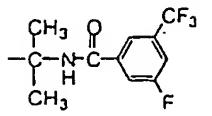
Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
760	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
761	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
762	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
763	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
764	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
765	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
766	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
767	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
768	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
769	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
770	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	

Table 1.7.1

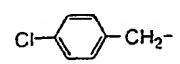
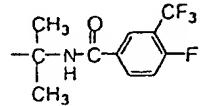
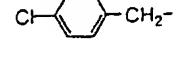
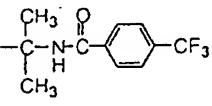
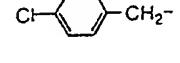
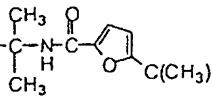
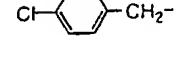
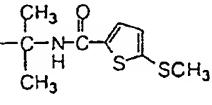
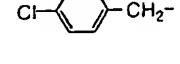
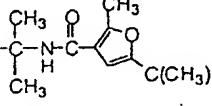
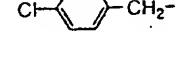
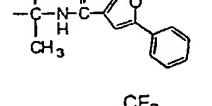
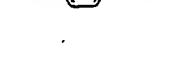
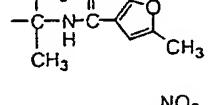
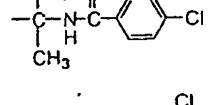
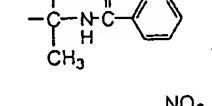
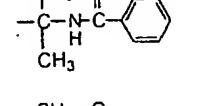
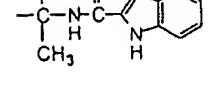
Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4 R^5 R^6	
	$\text{--}(\text{CH}_2)_p\text{--}$	$\text{--}(\text{CH}_2)_q\text{--}$	G--R^6	
771		2	H	
772		2	H	
773		2	H	
774		2	H	
775		2	H	
776		2	H	
777		2	H	
778		2	H	
779		2	H	
780		2	H	
781		2	H	

Table 1.72

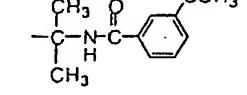
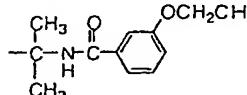
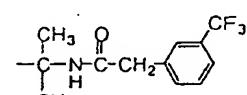
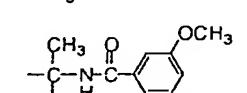
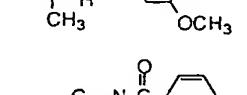
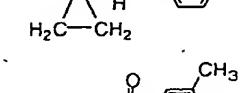
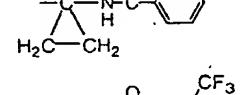
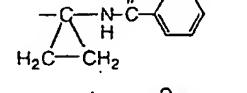
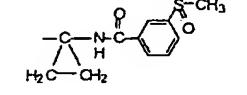
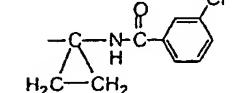
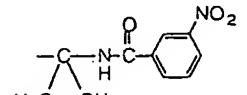
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{G}-\text{R}^6$
782	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
783	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
784	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
785	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
786	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
787	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
788	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
789	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
790	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
791	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
792	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	

Table 1.73

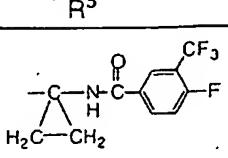
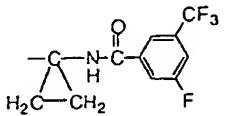
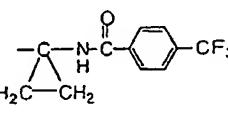
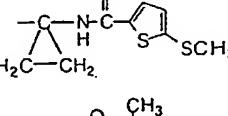
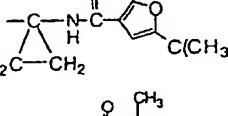
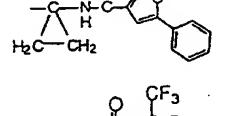
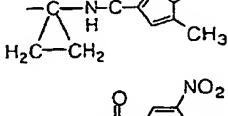
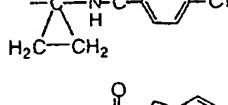
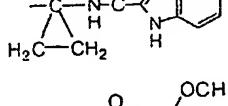
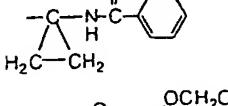
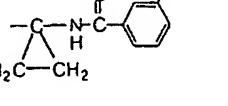
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
793	Cl-  -CH ₂ -	2	2	1	-	H	
794	Cl-  -CH ₂ -	2	2	1	-	H	
795	Cl-  -CH ₂ -	2	2	1	-	H	
796	Cl-  -CH ₂ -	2	2	1	-	H	
797	Cl-  -CH ₂ -	2	2	1	-	H	
798	Cl-  -CH ₂ -	2	2	1	-	H	
799	Cl-  -CH ₂ -	2	2	1	-	H	
800	Cl-  -CH ₂ -	2	2	1	-	H	
801	Cl-  -CH ₂ -	2	2	1	-	H	
802	Cl-  -CH ₂ -	2	2	1	-	H	
803	Cl-  -CH ₂ -	2	2	1	-	H	

Table 1.74

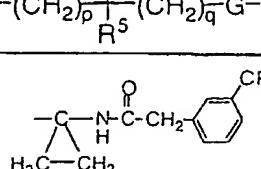
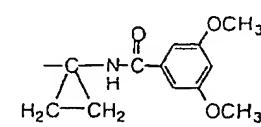
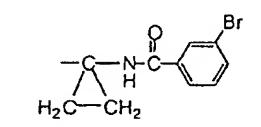
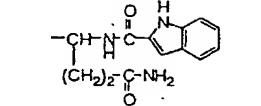
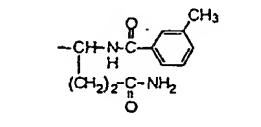
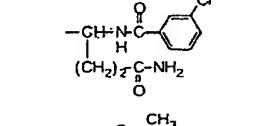
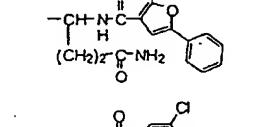
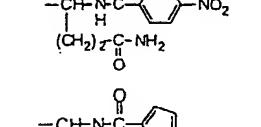
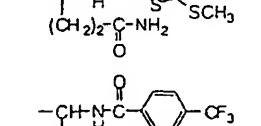
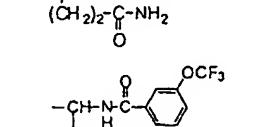
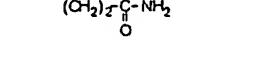
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{C}(\text{R}^4)$ $\text{C}(\text{R}^5)$ $-(\text{CH}_2)_q$ $\text{G}-\text{R}^6$
804	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
805	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
806	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
807	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
808	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
809	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
810	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
811	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
812	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
813	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
814	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	

Table 1.75

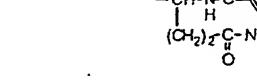
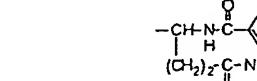
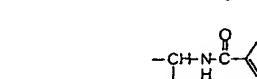
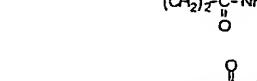
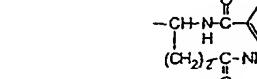
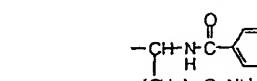
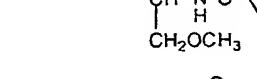
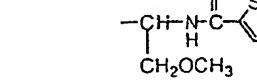
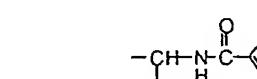
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_p\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
815	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
816	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
817	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
818	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
819	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
820	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
821	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
822	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
823	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
824	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
825	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	

Table 1.76

Compd. No.	R^1	R^2	$(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$	R^4	$(CH_2)_q$	$G-R^6$
826			$-CH_2-$	2	2	1	-	H				
827			$-CH_2-$	2	2	1	-	H				
828			$-CH_2-$	2	2	1	-	H				
829			$-CH_2-$	2	2	1	-	H				
830			$-CH_2-$	2	2	1	-	H				
831			$-CH_2-$	2	2	1	-	H				
832			$-CH_2-$	2	2	1	-	H				
833			$-CH_2-$	2	2	1	-	H				
834			$-CH_2-$	2	2	1	-	H				
835			$-CH_2-$	2	2	1	-	H				
836			$-CH_2-$	2	2	1	-	H				

Table 1.77

Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4	R^5	R^6		
	CH_2-CH_2-		$-(\text{CH}_2)_p$	CH_2-CH_2-	$\text{G}-\text{R}^6$		
837		2	2	1	-	H	
838		2	2	1	-	H	
839		2	2	1	-	H	
840		2	2	1	-	H	
841		2	2	1	-	H	
842		2	2	1	-	H	
843		2	2	1	-	H	
844		2	2	1	-	H	
845		2	2	1	-	H	
846		2	2	1	-	H	
847		2	2	1	-	H	

Table 1.78

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}(\text{CH}_2)$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^5 R^4 $-(\text{CH}_2)_q$ $\text{G}-\text{R}^6$
848	<chem>CC1=CC=C(Cl)C=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)C</chem>
849	<chem>CC1=CC=C(Cl)C=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)OC</chem>
850	<chem>CC1=CC=C(Cl)C=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)S(=O)(=O)c1ccc(cc1)C</chem>
851	<chem>CC1=CC=C(Cl)C=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
852	<chem>CC1=CC=C(Cl)C=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
853	<chem>CC1=CC=C(Cl)C=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(cc1)C</chem>
854	<chem>CC1=CC=C(Cl)C=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(cc1)CCH3</chem>
855	<chem>CC1=CC=C(Cl)C=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(cc1)CCH3</chem>
856	<chem>CC1=CC=C(Cl)C=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(cc1)C(=O)C</chem>
857	<chem>CC1=CC=C(Cl)C=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(cc1)OC</chem>
858	<chem>CC1=CC=C(Cl)C=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(cc1)OC</chem>

Table 1.79

Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4 R^5	R^6			
	CH_2-CH_2-		$-(\text{CH}_2)_p$	$-(\text{CH}_2)_q\text{G}-$			
859		2	2	1	-	H	
860		2	2	1	-	H	
861		2	2	1	-	H	
862		2	2	1	-	H	
863		2	2	1	-	H	
864		2	2	1	-	H	
865		2	2	1	-	H	
866		2	2	1	-	H	
867		2	2	1	-	H	
868		2	2	1	-	H	
869		2	2	1	-	H	

Table 1.80

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{R}^4\text{R}^5(\text{CH}_2)_q\text{G}-\text{R}^6$
870	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{S}(=\text{O})_2\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
871	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{S}(=\text{O})_2\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$
872	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{S}(=\text{O})_2\text{C}_6\text{H}_4$
873	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{OCH}_2\text{C}_6\text{H}_4$
874	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{O}(\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{H})\text{C}_6\text{H}_4\text{Cl})\text{CH}_3$
875	$\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3$
876	$\text{BrC}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3$
877	$\text{NC}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3$
878	$\text{O}_2\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3$
879	$\text{O}_2\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3$
880	$\text{O}_2\text{C}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3$

Table 1.8.1

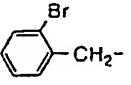
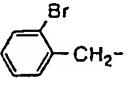
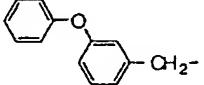
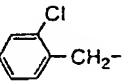
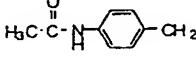
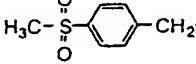
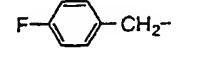
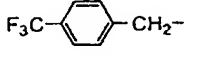
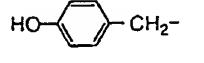
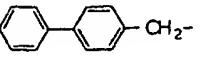
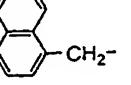
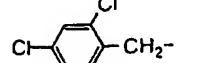
Compd. No.	R^1 R^2 Br 	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^4 R^5 $-(\text{CH}_2)_q$ G-R^6
881		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
882		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
883		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
884		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
885		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
886		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
887		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
888		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
889		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
890		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
891		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$

Table 1.82

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
892		2	2	1	-	H	
893		2	2	1	-	H	
894		2	2	1	-	H	
895		2	2	1	-	H	
896		2	2	1	-	H	
897		2	2	1	-	H	
898		2	2	1	-	H	
899		2	2	1	-	H	
900		2	2	1	-	H	
901		2	2	1	-	H	
902		2	2	1	-	H	

Table 1.83

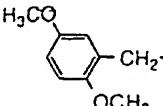
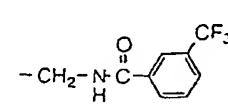
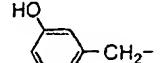
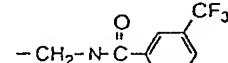
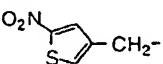
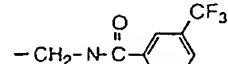
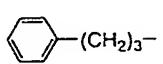
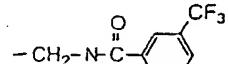
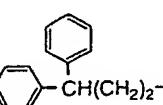
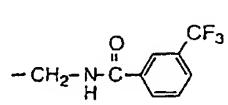
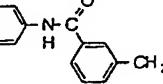
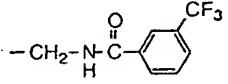
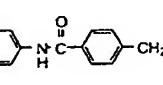
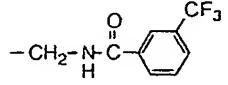
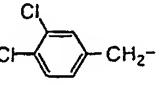
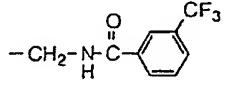
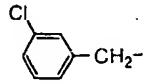
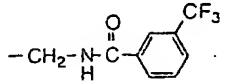
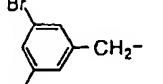
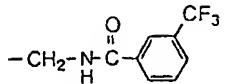
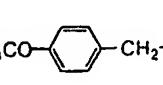
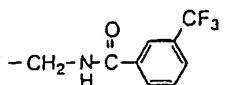
Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
903		2	2	1	-	H	
904		2	2	1	-	H	
905		2	2	1	-	H	
906		2	2	1	-	H	
907		2	2	1	-	H	
908		2	2	1	-	H	
909		2	2	1	-	H	
910		2	2	1	-	H	
911		2	2	1	-	H	
912		2	2	1	-	H	
913		2	2	1	-	H	

Table 1.8.4

Compd. No.	R_1^1 R_2^1	$(CH_2)_j^-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p^1$ $\begin{array}{c} R^4 \\ \\ -(CH_2)_q^1 \\ \\ R^5 \end{array}$ G-R ⁶
914		$-\text{CH}_2\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
915		$-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OH})-\text{C}_6\text{H}_4^-$	2	2	1	-	H	
916		$-\text{CH}_2-\text{C}_5\text{H}_4\text{N}_3^-$	2	2	1	-	H	
917		$-\text{CH}_2-\text{C}_5\text{H}_3\text{N}_3^-$	2	2	1	-	H	
918		$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CO}_2\text{H})_2^-$	2	2	1	-	H	
919		$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
920		$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCF}_3^-$	2	2	1	-	H	
921		$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2^-$	2	2	1	-	H	
922		$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_{11}^-$	2	2	1	-	H	
923		$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2\text{Cl}^-$	2	2	1	-	H	
924		$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_3(\text{NH}_2)_2^-$	2	2	1	-	H	

Table 1.85

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagdown \\ R^2 \end{array} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} (CH_2)_l \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \begin{array}{c} R^4 \\ \diagup \\ R^5 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
925		2	2	1	-	H	
926		2	2	1	-	H	
927		2	2	1	-	H	
928		2	2	1	-	H	
929		2	2	1	-	H	
930		2	2	1	-	H	
931		2	2	1	-	H	
932		2	2	1	-	H	
933		2	2	1	-	H	
934		2	2	1	-	H	
935		2	2	1	-	H	

Table 1.86

Compd. No.	R^1 R^2 \longrightarrow $(CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ $\overset{R^4}{\underset{R^5}{\lvert\!\lvert}} (CH_2)_q$ G $\longrightarrow R^6$
936		2	2	1	-	H	
937	$(H_3C)_2N$	2	2	1	-	H	
938		2	2	1	-	H	
939		2	2	1	-	H	
940		2	2	1	-	H	
941		2	2	1	-	H	
942		2	2	1	-	H	
943		1	4	0	-	H	
944		1	4	0	-	H	
945		1	4	0	-	H	
946		1	4	0	-	H	

Table 1.8.7

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
947		1	4	0	-	H	
948		1	4	0	-	H	
949		1	4	0	-	H	
950		0	4	1	-	H	
951		1	2	0	R	H	
952		1	2	0	R	H	
953		1	2	0	R	H	
954		1	2	0	R	H	
955		1	2	0	R	H	
956		1	2	0	R	H	
957		1	2	0	R	H	

Table 1.88

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-(CH_2)_l- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
958	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-C(=O)c1ccccc1-OH$
959	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^H-\text{C}(=\text{O})-\text{c}_1\text{ccc}(\text{N}^H-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_3)\text{cc}_1$
960	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-\text{C}(=\text{O})-\text{c}_1\text{ccc}(\text{N}^H-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_3)\text{cc}_1$
961	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^H-\text{C}(=\text{O})-\text{c}_1\text{ccc}(\text{N}^H-\text{CH}_3)\text{cc}_1$
962	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-\text{C}(=\text{O})-\text{c}_1\text{ccc}(\text{N}^H-\text{CH}_3)\text{cc}_1$
963	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-\text{C}(=\text{O})-\text{c}_1\text{ccc}(\text{OH})\text{cc}_1$
964	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^H-\text{C}(=\text{O})-\text{c}_1\text{ccc}(\text{CO}_2\text{CH}_3)\text{cc}_1$
965	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-\text{C}(=\text{O})-\text{c}_1\text{ccc}(\text{CO}_2\text{CH}_3)\text{cc}_1$
966	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^H-\text{C}(=\text{O})-\text{c}_1\text{ccc}(\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_3)\text{cc}_1$
967	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-N^H-\text{C}(=\text{O})-\text{c}_1\text{ccc}(\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_3)\text{cc}_1$
968	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^H-\text{C}(=\text{O})-\text{c}_1\text{ccc}(\text{c}_2\text{cc}(\text{N})\text{cc}_2)\text{cc}_1$

Table 1.89

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^4 R^5 $\text{---}(\text{CH}_2)_q$ G-R ⁶
969		1	2	0	R	H	
970		1	2	0	R	H	
971		1	2	0	R	H	
972		1	2	0	R	H	
973		1	2	0	R	H	
974		1	2	0	R	H	
975		1	2	0	R	H	
976		1	2	0	R	H	
977		1	2	0	R	H	
978		1	2	0	R	H	
979		1	2	0	R	H	

Table 1.90

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
980		1	2	0	R	H	
981		1	2	0	R	H	
982		1	2	0	R	H	
983		1	2	0	R	H	
984		1	2	0	R	H	
985		1	2	0	R	H	
986		1	2	0	R	H	
987		2	2	1	-	H	
988		1	4	0	-	H	
989		1	4	0	-	H	
990		1	4	0	-	H	

Table 1.91

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^4 R^5 $-(\text{CH}_2)_q$ $\text{G}-\text{R}^6$
991	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-$
992	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
993	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
994	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-$
995	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
996	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-$
997	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-$
998	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
999	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
1000	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
1001	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3$

Table 1.9.2

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{---}R^5$ $\text{---}(\text{CH}_2)_q$ G-R ⁶
1002		2	2	1	-	H	
1003		2	2	1	-	H	
1004		2	2	1	-	H	
1005		2	2	1	-	H	
1006		2	2	1	-	H	
1007		2	2	1	-	H	
1008		2	2	1	-	H	
1009		2	2	1	-	H	
1010		2	2	1	-	H	
1011		2	2	1	-	H	
1012		2	2	1	-	H	

1 1 2

Table 1.9.3

Compd. No.	R^1 R^2	$(CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$	$\begin{array}{c} R^4 \\ \\ -(CH_2)_q-G-R^6 \\ \\ R^5 \end{array}$
1013		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
1014		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
1015		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
1016		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H		
1017		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H		
1018		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
1019		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
1020		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
1021		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
1022		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
1023		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		

Table 1.9.4

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---} (CH_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \text{---} \begin{array}{c} R^4 \\ \\ -CH-N-C(=O)- \\ \\ CH_3 \end{array} \text{---} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1024		2	2	1	-	H	
1025		2	2	1	-	H	
1026		2	2	1	-	H	
1027		2	2	1	-	H	
1028		2	2	1	-	H	
1029		2	2	1	-	H	
1030		2	2	1	-	H	
1031		2	2	1	-	H	
1032		2	2	1	-	H	
1033		2	2	1	-	H	
1034		2	2	1	-	H	

Table 1.95

Compd. No.	R_1 R_2 $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{G}-\text{R}^6$
1035	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(R)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1036	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(R)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1037	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(R)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
1038	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(R)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CF}_3$
1039	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(R)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1040	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(R)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCF}_3$
1041	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(R)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
1042	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Br}$
1043	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
1044	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
1045	$\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$

Table 1.96

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1046	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl}, \text{H}_2\text{N})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl}, \text{H}_2\text{N})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{CH}_2-$
1047	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3, \text{H}_2\text{N})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3, \text{H}_2\text{N})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{CH}_2-$
1048	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3, \text{H}_2\text{N})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3, \text{OCH}_3)-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{CH}_2-$
1049	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3, \text{H}_2\text{N})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br}, \text{H}_2\text{N})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{CH}_2-$
1050	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(\text{S})-\text{CH}(\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3)-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2-\text{OCH}_3$
1051	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(\text{S})-\text{CH}(\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3)-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}_2\text{CH}_3$
1052	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(\text{S})-\text{CH}(\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3)-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2-\text{OCH}_3$
1053	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(\text{S})-\text{CH}(\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3)-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1054	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(\text{S})-\text{CH}(\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3)-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1055	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(\text{S})-\text{CH}(\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3)-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1056	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$(\text{S})-\text{CH}(\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3)-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2-\text{OCH}_2\text{CF}_3$

Table 1.97

Compd. No.	R^1 R^2	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ R^5	$(CH_2)_q$ $G-R^6$
1057	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	2	2	1	-	H	(R) $-\overset{\underset{\text{H}}{\text{CH}}}{\text{N}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3$	
1058	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	2	2	1	-	H	(S) $-\overset{\underset{\text{H}}{\text{CH}}}{\text{N}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$	
1059	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	2	2	1	-	H	(S) $-\overset{\underset{\text{H}}{\text{CH}}}{\text{N}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCF}_3$	
1060	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	2	2	1	-	H	(R) $-\overset{\underset{\text{H}}{\text{CH}}}{\text{N}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$	
1061	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	2	2	1	-	H	(R) $-\overset{\underset{\text{H}}{\text{CH}}}{\text{N}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CF}_3$	
1062	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	2	2	1	-	H	(S) $-\overset{\underset{\text{H}}{\text{CH}}}{\text{N}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3$	
1063	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	2	2	1	-	H	(R) $-\overset{\underset{\text{H}}{\text{CH}}}{\text{N}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$	
1064	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	2	2	1	-	H	(R) $-\overset{\underset{\text{H}}{\text{CH}}}{\text{N}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCF}_3$	
1065	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	2	2	1	-	H	(R) $-\overset{\underset{\text{H}}{\text{CH}}}{\text{N}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$	
1066	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	2	2	1	-	H	(R) $-\overset{\underset{\text{H}}{\text{CH}}}{\text{N}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2\text{CH}_3$	
1067	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CC2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)C=C4C=CC=C4</chem>	2	2	1	-	H	(R) $-\overset{\underset{\text{H}}{\text{CH}}}{\text{N}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$	

Table 1.98

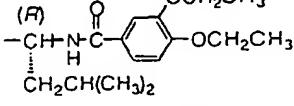
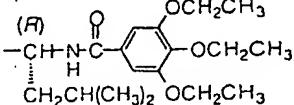
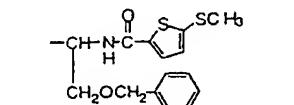
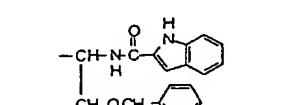
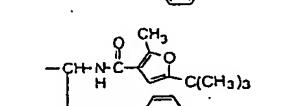
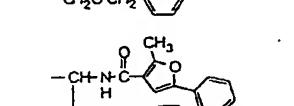
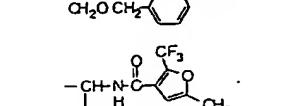
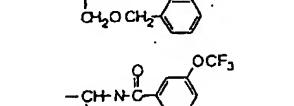
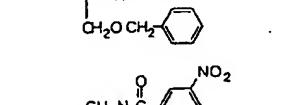
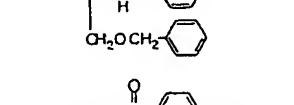
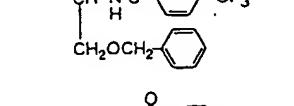
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1068	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1069	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1070	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1071	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1072	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1073	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1074	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1075	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1076	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1077	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1078	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	

Table 1.99

Compd. No.	R^1 R^2	$(CH_2)_j^-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p^4$ R^5	$(CH_2)_q^-$ $G-R^6$
1079		CH_2^-	2	2	1	-	H		
1080		CH_2^-	2	2	1	-	H		
1081		CH_2^-	2	2	1	-	H		
1082		CH_2^-	2	2	1	-	H		
1083		CH_2^-	2	2	1	-	H		
1084		CH_2^-	1	2	0	R	H		
1085		CH_2^-	1	2	0	R	H		
1086		CH_2^-	1	2	0	R	H		
1087		CH_2^-	1	2	0	R	H		
1088		CH_2^-	1	2	0	R	H		
1089		CH_2^-	1	2	0	R	H		

Table 1.100

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{C}(\text{R}^4)\text{R}^5(\text{CH}_2)_q\text{G}-\text{R}^6$
1090	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1091	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{NH}_2-\text{Cl}$
1092	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{NH}_2-\text{NO}_2$
1093	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{NH}_2$
1094	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}$
1095	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}$
1096	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}$
1097	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1098	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3-\text{Br}$
1099	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F}-\text{Br}$
1100	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F}-\text{Cl}$

Table 1.101

Compd. No.	R_1 R_2 $\text{---} (CH_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ $\overset{R^4}{R_5} \text{---} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1101	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem> $\text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(I)cc1</chem>
1102	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem> $\text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc([N+](=O)[O-])cc1</chem>
1103	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem> $\text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(Br)cc1</chem>
1104	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem> $\text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(F)cc1</chem>
1105	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem> $\text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(Cl)cc1</chem>
1106	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem> $\text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(I)cc1</chem>
1107	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem> $\text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc([N+](=O)[O-])cc1</chem>
1108	<chem>CC1=CC=C2C(=O)N(C)C=C2O1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(Br)cc1</chem>
1109	<chem>CC1=CC=C2C(=O)N(C)C=C2O1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(F)cc1</chem>
1110	<chem>CC1=CC=C2C(=O)N(C)C=C2O1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(Cl)cc1</chem>
1111	<chem>CC1=CC=C2C(=O)N(C)C=C2O1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(I)cc1</chem>

121

Table 1.102

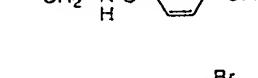
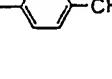
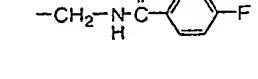
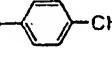
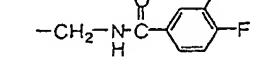
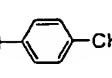
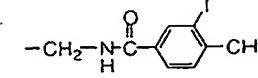
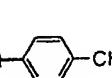
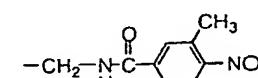
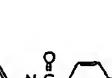
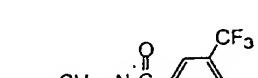
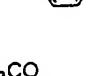
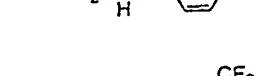
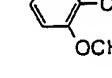
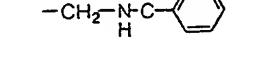
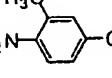
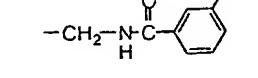
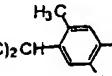
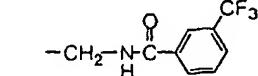
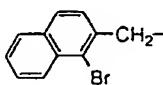
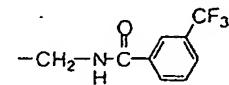
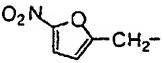
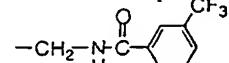
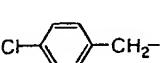
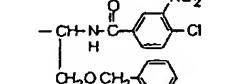
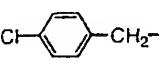
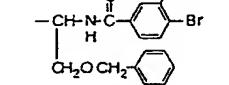
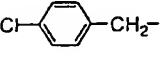
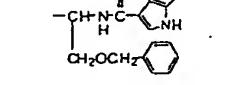
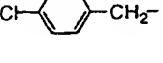
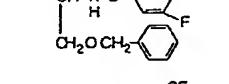
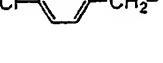
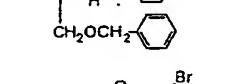
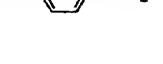
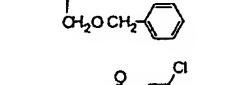
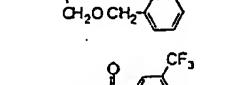
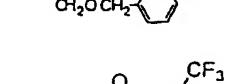
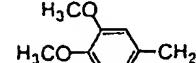
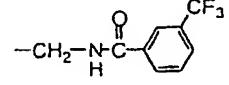
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1112		1	2	0	R	H	
1113		2	2	1	-	H	
1114		2	2	1	-	H	
1115		2	2	1	-	H	
1116		2	2	1	-	H	
1117		2	2	1	-	H	
1118		1	2	0	R	H	
1119		1	2	0	R	H	
1120		1	2	0	R	H	
1121		1	2	0	R	H	
1122		1	2	0	R	H	

Table 1.103

Compd. No.	R^1 R^2	R^3	k	m	n	chirality	R^4 R^5	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1123		H	1	2	0	R		
1124		H	1	2	0	R		
1125		H	2	2	1	-		
1126		H	2	2	1	-		
1127		H	2	2	1	-		
1128		H	2	2	1	-		
1129		H	2	2	1	-		
1130		H	2	2	1	-		
1131		H	2	2	1	-		
1132		H	2	2	1	-		
1133		H	1	2	0	R		

1 2 3

Table 1.104

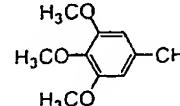
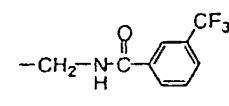
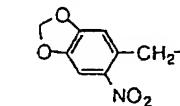
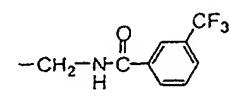
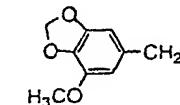
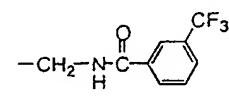
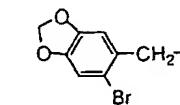
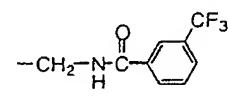
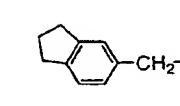
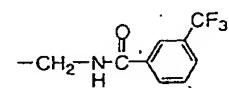
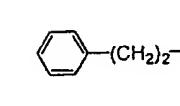
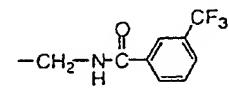
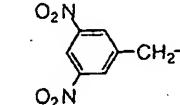
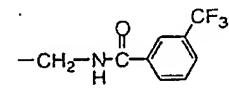
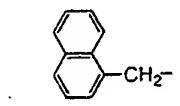
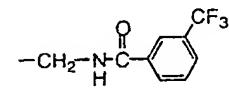
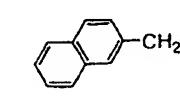
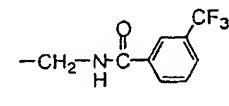
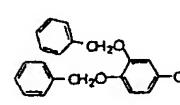
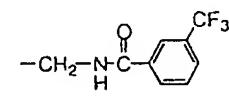
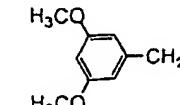
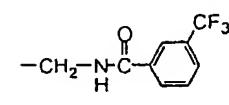
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
1134		1	2	0	R	H	
1135		1	2	0	R	H	
1136		1	2	0	R	H	
1137		1	2	0	R	H	
1138		1	2	0	R	H	
1139		1	2	0	R	H	
1140		1	2	0	R	H	
1141		1	2	0	R	H	
1142		1	2	0	R	H	
1143		1	2	0	R	H	
1144		1	2	0	R	H	

Table 1.105

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\begin{array}{c} \text{R}^4 \\ \\ \text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---} \end{array}\text{G---R}^6$
1145		1	2	0	R	H	
1146		1	2	0	R	H	
1147		1	2	0	R	H	
1148		1	2	0	R	H	
1149		1	2	0	R	H	
1150		1	2	0	R	H	
1151		1	2	0	R	H	
1152		1	2	0	R	H	
1153		1	2	0	R	H	
1154		1	2	0	R	H	
1155		1	2	0	R	H	

Table 1.106

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_i\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
1156		1	2	0	R	H	
1157		1	2	0	R	H	
1158		1	2	0	R	H	
1159		1	2	0	R	H	
1160		1	2	0	R	H	
1161		1	2	0	R	H	
1162		1	2	0	R	H	
1163		1	2	0	R	H	
1164		1	2	0	R	H	
1165		1	2	0	R	H	
1166		1	2	0	R	H	

Table 1.107

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
1167		2	2	1	-	H	
1168		1	2	0	R	H	
1169		1	2	0	R	H	
1170		1	2	0	R	H	
1171		1	2	0	R	H	
1172		1	2	0	R	H	
1173		1	2	0	R	H	
1174		1	2	0	R	H	
1175		1	2	0	R	H	
1176		1	2	0	R	H	
1177		1	2	0	R	H	

Table 1.108

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1178	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(F)cc1</chem>
1179	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc([N+](=O)[O-])cc1</chem>
1180	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc2ccccc2n1</chem>
1181	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C2=CC=CC=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(C)c(Br)cc1</chem>
1182	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C2=CC=CC=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc2cc(O)ccn21</chem>
1183	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C2=CC=CC=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc2cc(O)ccn21</chem>
1184	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C2=CC=CC=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(F)cc1</chem>
1185	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C2=CC=CC=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc([N+](=O)[O-])cc1</chem>
1186	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C2=CC=CC=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc2cc(O)ccn21</chem>
1187	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(C)c(Br)cc1</chem>
1188	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc2cc(O)ccn21</chem>

Table 1.109

Compd. No.	R^1 R^2 — $(\text{CH}_2)_l$ —	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ — $\begin{array}{c} \text{R}^4 \\ \\ \text{R}^5 \end{array}$ — $(\text{CH}_2)_q$ —G— R^6
1189		2	2	1	-	H	
1190		2	2	1	-	H	
1191		1	2	0	R	H	
1192		1	2	0	R	H	
1193		1	2	0	R	H	
1194		1	2	0	R	H	
1195		1	2	0	R	H	
1196		1	2	0	R	H	
1197		1	2	0	R	H	
1198		1	2	0	R	H	
1199		1	2	0	R	H	

Table 1.110

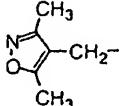
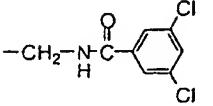
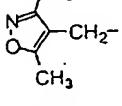
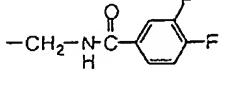
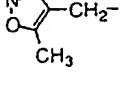
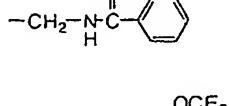
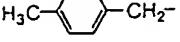
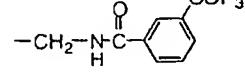
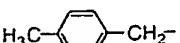
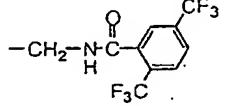
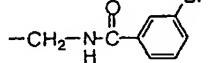
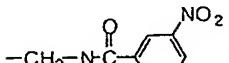
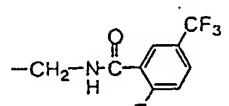
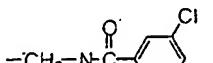
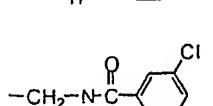
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---R}^6$
1200		1	2	0	R	H	
1201		1	2	0	R	H	
1202		1	2	0	R	H	
1203		1	2	0	R	H	
1204		1	2	0	R	H	
1205		1	2	0	R	H	
1206		1	2	0	R	H	
1207		1	2	0	R	H	
1208		1	2	0	R	H	
1209		1	2	0	R	H	
1210		1	2	0	R	H	

Table 1.111

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---R}^6$
1211	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{F}$
1212	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CF}_3$
1213	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CF}_3$
1214	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{F}$
1215	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{Cl}$
1216	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{F}$
1217	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{Cl}$
1218	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_3$
1219	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_3$
1220	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{H}_2\text{N}$
1221	$\text{Cl---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{F}$

Table 1.112

Compd. No.	R^1 R^2 > $(CH_2)_j$ >	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\ \\ -(CH_2)_q G - R^6 \\ \\ R^5 \end{array}$
1222	<chem>CC1=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1cc[nH]c1</chem>
1223	<chem>CC1=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccccc1Sc2ccccc2</chem>
1224	<chem>CC1=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(O)c2c1C(=O)Nc2O</chem>
1225	<chem>CC1=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(Cl)c(C(F)(F)F)c1</chem>
1226	<chem>CC1=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(F)c(C(F)(F)F)c1</chem>
1227	<chem>CC1=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(Cl)c(C(F)(F)F)c1</chem>
1228	<chem>CC1=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(N)c2cc(I)cc2c1</chem>
1229	<chem>CC1=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(F)c(F)c1</chem>
1230	<chem>CC1=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1cc[nH]c1</chem>
1231	<chem>CC1=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccccc1Sc2ccccc2</chem>
1232	<chem>CC1=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)Nc1ccc(O)c2c1C(=O)Nc2O</chem>

Table 1.113

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1233		1	2	0	R	H	
1234		1	2	0	R	H	
1235		1	2	0	R	H	
1236		1	2	0	R	H	
1237		1	2	0	R	H	
1238		1	2	0	R	H	
1239		1	2	0	R	H	
1240		1	2	0	R	H	
1241		2	2	1	-	H	
1242		2	2	1	-	H	
1243		2	2	1	-	H	

Table 1.114

Compd. No.	R^1 R^2	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p \text{R}^4 \text{R}^5 \text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
1244		2	2	1	-	H	
1245		2	2	1	-	H	
1246		2	2	1	-	H	
1247		2	2	1	-	H	
1248		2	2	1	-	H	
1249		1	2	0	R	H	
1250		1	2	0	R	H	
1251		1	2	0	R	H	
1252		1	2	0	R	H	
1253		1	2	0	R	H	
1254		1	2	0	R	H	

Table 1.115

Compd. No.	R^1 R^2	$(CH_2)_i$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ R^5	$(CH_2)_q$ R^4	$G-R^6$
1255			1	2	0	R	H			
1256			1	2	0	R	H			
1257			1	2	0	R	H			
1258			1	2	0	R	H			
1259			1	2	0	R	H			
1260			1	2	0	R	H			
1261			1	2	0	R	H			
1262			1	2	0	R	H			
1263			1	2	0	R	H			
1264			1	2	0	R	H			
1265			1	2	0	R	H			

Table 1.116

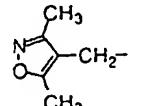
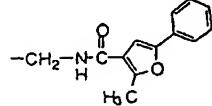
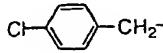
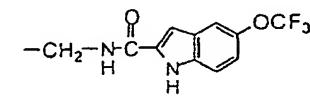
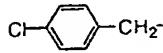
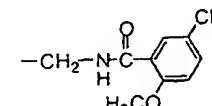
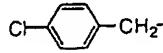
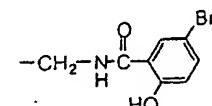
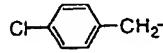
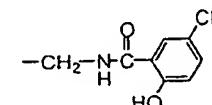
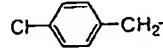
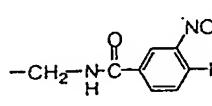
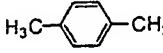
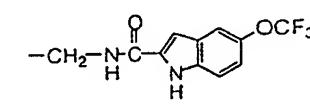
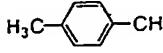
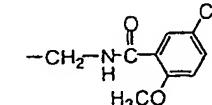
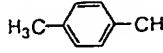
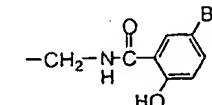
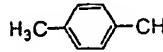
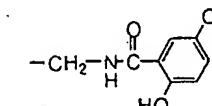
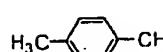
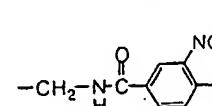
Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2-(CH_2)_l- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}(CH_2)_q-G-R^6$
1266		1	2	0	R	H	
1267		1	2	0	R	H	
1268		1	2	0	R	H	
1269		1	2	0	R	H	
1270		1	2	0	R	H	
1271		1	2	0	R	H	
1272		1	2	0	R	H	
1273		1	2	0	R	H	
1274		1	2	0	R	H	
1275		1	2	0	R	H	
1276		1	2	0	R	H	

Table 1.117

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{R}^1$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{C}(\text{R}^4)\text{CH}_2\text{G}-\text{R}^6$
1277		1	2	0	R	H	
1278		1	2	0	R	H	
1279		1	2	0	R	H	
1280		1	2	0	R	H	
1281		1	2	0	R	H	
1282		2	2	1	-	H	
1283		2	2	1	-	H	
1284		2	2	1	-	H	
1285		2	2	1	-	H	
1286		1	2	0	R	H	
1287		1	2	0	R	H	

Table 1.118

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
1288		1	2	0	R	H	
1289		1	2	0	R	H	
1290		1	2	0	R	H	
1291		1	2	0	R	H	
1292		1	2	0	R	H	
1293		1	2	0	R	H	
1294		1	2	0	R	H	
1295		1	2	0	R	H	
1296		1	2	0	R	H	
1297		1	2	0	R	H	
1298		1	2	0	R	H	

Table 1.119

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \text{---} (CH_2)_l \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
1299		1	2	0	R	H	
1300		1	2	0	R	H	
1301		1	2	0	R	H	
1302		1	2	0	R	H	
1303		1	2	0	R	H	
1304		1	2	0	R	H	
1305		1	2	0	R	H	
1306		1	2	0	R	H	
1307		1	2	0	R	H	
1308		1	2	0	R	H	
1309		1	2	0	R	H	

Table 1.120

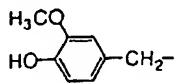
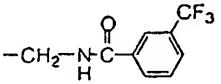
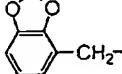
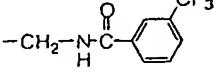
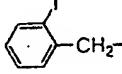
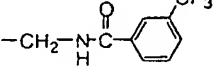
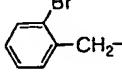
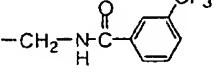
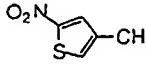
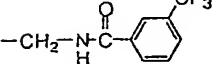
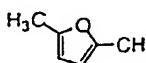
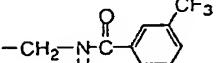
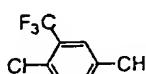
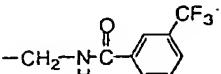
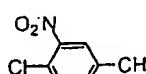
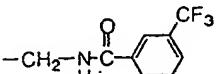
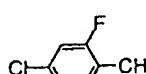
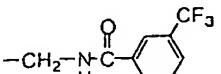
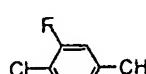
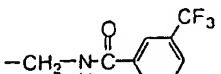
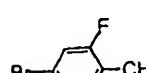
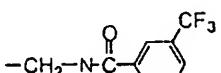
Compd. No.	R^1 R^2 - CH_2-	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^5 R^4 $\text{CH}_2)_q$ G-R ⁶
1310		1	2	0	R	H	
1311		1	2	0	R	H	
1312		1	2	0	R	H	
1313		1	2	0	R	H	
1314		1	2	0	R	H	
1315		1	2	0	R	H	
1316		1	2	0	R	H	
1317		1	2	0	R	H	
1318		1	2	0	R	H	
1319		1	2	0	R	H	
1320		1	2	0	R	H	

Table 1.121

Compd. No.	R^1 $\text{R}^2 > (\text{CH}_2)_l <$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\ \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
1321		1	2	0	R	H	
1322		1	2	0	R	H	
1323		1	2	0	R	H	
1324		1	2	0	R	H	
1325		1	2	0	R	H	
1326		1	2	0	R	H	
1327		1	2	0	R	H	
1328		1	2	0	R	H	
1329		1	2	0	R	H	
1330		1	2	0	R	H	
1331		1	2	0	R	H	

Table 1.122

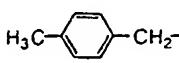
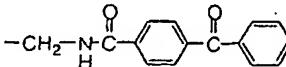
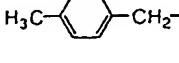
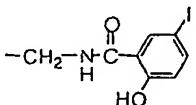
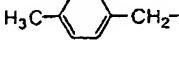
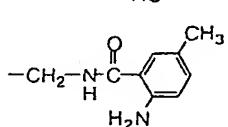
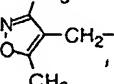
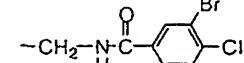
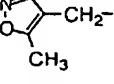
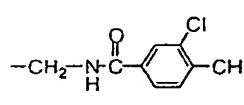
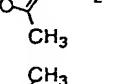
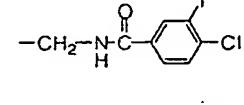
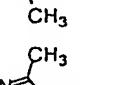
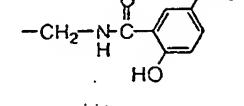
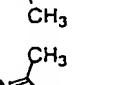
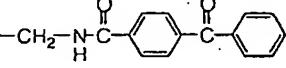
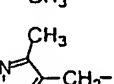
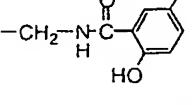
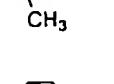
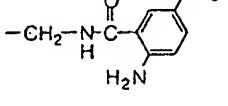
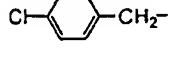
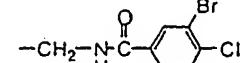
Compd. No.	R^1 R^2	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
1332		1	2	0	R	H	
1333		1	2	0	R	H	
1334		1	2	0	R	H	
1335		1	2	0	R	H	
1336		1	2	0	R	H	
1337		1	2	0	R	H	
1338		1	2	0	R	H	
1339		1	2	0	R	H	
1340		1	2	0	R	H	
1341		1	2	0	R	H	
1342		2	2	1	-	H	

Table 1.123

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_p -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1343		2	2	1	-	H	
1344		2	2	1	-	H	
1345		2	2	1	-	H	
1346		2	2	1	-	H	
1347		1	2	0	R	H	
1348		1	2	0	R	H	
1349		1	2	0	R	H	
1350		2	2	1	-	H	
1351		1	2	0	R	H	
1352		1	2	0	R	H	
1353		1	2	0	R	H	

Table 1.124

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_l -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \diagup \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
1354		2	2	1	-	H	
1355		1	2	0	R	H	
1356		1	2	0	R	H	
1357		1	2	0	R	H	
1358		2	2	1	-	H	
1359		1	2	0	R	H	
1360		1	2	0	R	H	
1361		1	2	0	R	H	
1362		1	2	0	R	H	
1363		1	2	0	R	H	
1364		1	2	0	R	H	

Table 1.125

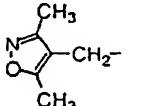
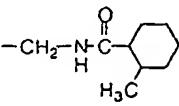
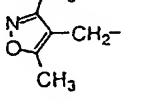
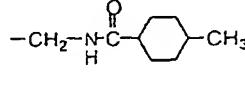
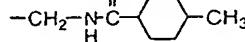
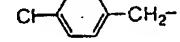
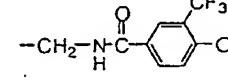
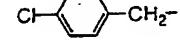
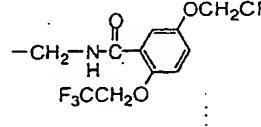
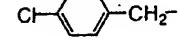
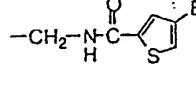
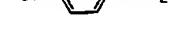
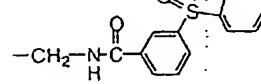
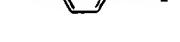
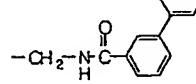
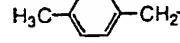
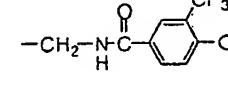
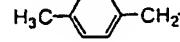
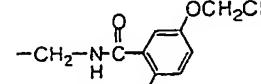
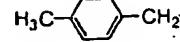
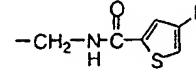
Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2- \\ \\ CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
1365		1	2	0	R	H	
1366		1	2	0	R	H	
1367		1	2	0	R	H	
1368		1	2	0	R	H	
1369		1	2	0	R	H	
1370		1	2	0	R	H	
1371		1	2	0	R	H	
1372		1	2	0	R	H	
1373		1	2	0	R	H	
1374		1	2	0	R	H	
1375		1	2	0	R	H	

Table 1.126

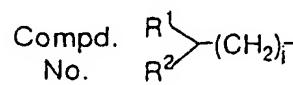
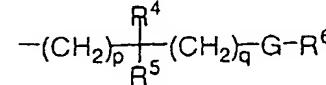
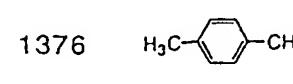
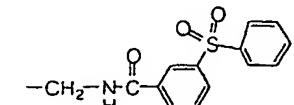
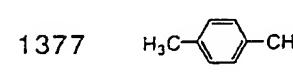
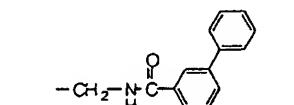
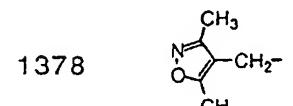
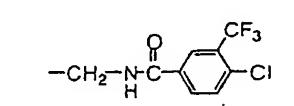
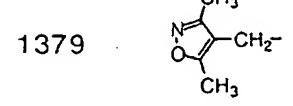
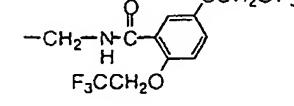
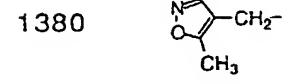
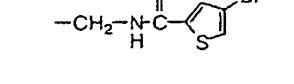
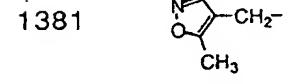
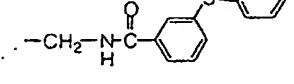
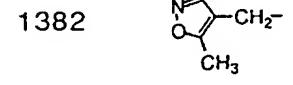
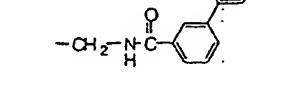
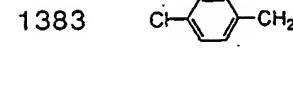
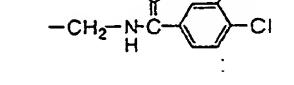
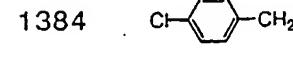
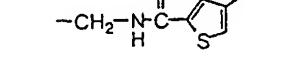
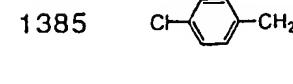
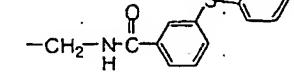
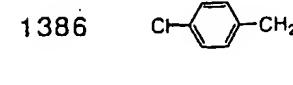
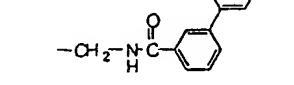
Compd. No.		k	m	n	chirality	R ³	
1376		1	2	0	R	H	
1377		1	2	0	R	H	
1378		1	2	0	R	H	
1379		1	2	0	R	H	
1380		1	2	0	R	H	
1381		1	2	0	R	H	
1382		1	2	0	R	H	
1383		2	2	1	-	H	
1384		2	2	1	-	H	
1385		2	2	1	-	H	
1386		2	2	1	-	H	

Table 1.127

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} \diagdown -(\text{CH}_2)_l-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \diagup \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q G - R^6$
1387		1	2	0	R	H	
1388		1	2	0	R	H	
1389		1	2	0	R	H	
1390		1	2	0	R	H	
1391		1	2	0	R	H	
1392		1	2	0	R	H	
1393		1	2	0	R	H	
1394		1	2	0	R	H	
1395		1	2	0	R	H	
1396		1	2	0	R	H	
1397		1	2	0	R	H	

Table 1.128

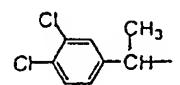
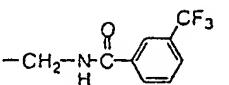
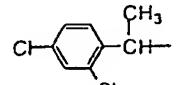
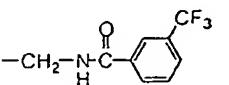
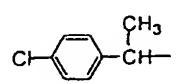
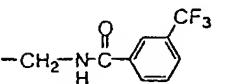
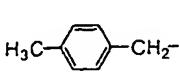
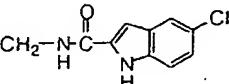
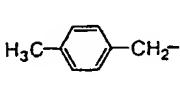
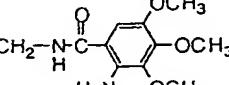
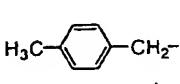
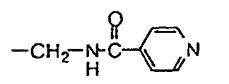
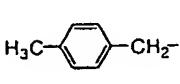
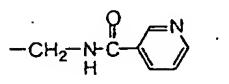
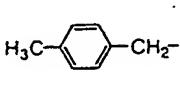
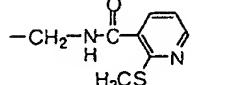
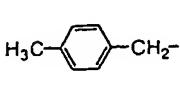
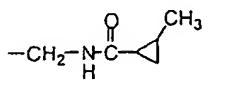
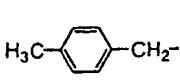
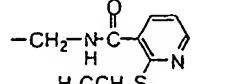
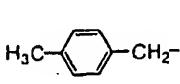
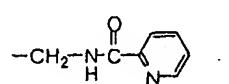
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{---}(\text{R}^4)$ $\text{---}(\text{CH}_2)_q$ $\text{---}(\text{R}^5)$ $\text{---}(\text{G})\text{---}\text{R}^6$
1398		1	2	0	R	H	
1399		1	2	0	R	H	
1400		1	2	0	R	H	
1401		1	2	0	R	H	
1402		1	2	0	R	H	
1403		1	2	0	R	H	
1404		1	2	0	R	H	
1405		1	2	0	R	H	
1406		1	2	0	R	H	
1407		1	2	0	R	H	
1408		1	2	0	R	H	

Table 1.129

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\overset{\substack{R^4 \\ }}{\underset{R^5}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1409		1	2	0	R	H	
1410		1	2	0	R	H	
1411		1	2	0	R	H	
1412		1	2	0	R	H	
1413		1	2	0	R	H	
1414		2	2	1	-	H	
1415		1	2	0	R	H	
1416		1	2	0	R	H	
1417		1	2	0	R	H	
1418		2	2	1	-	H	
1419		1	2	0	R	H	

Table 1.130

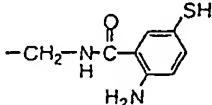
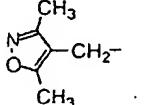
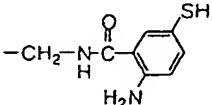
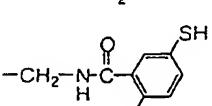
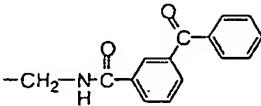
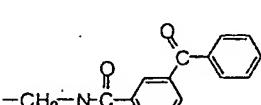
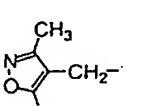
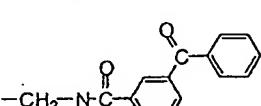
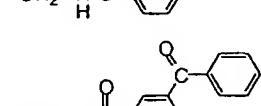
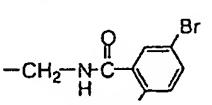
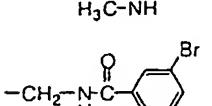
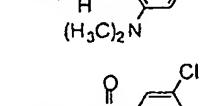
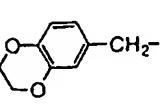
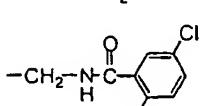
Compd. No.	R^1 R^2	$(CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ R^5	R^4 $(CH_2)_q$	G	R^6
1420	<chem>H3C-c1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_1$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$ R^5	R^4 $(CH_2)_q$		
1421		$(CH_2)_1$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$ R^5	R^4 $(CH_2)_q$		
1422	<chem>Cl-c1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$ R^5	R^4 $(CH_2)_q$		
1423	<chem>Cl-c1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_1$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$ R^5	R^4 $(CH_2)_q$		
1424	<chem>H3C-c1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_1$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$ R^5	R^4 $(CH_2)_q$		
1425		$(CH_2)_1$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$ R^5	R^4 $(CH_2)_q$		
1426	<chem>Cl-c1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$ R^5	R^4 $(CH_2)_q$		
1427	<chem>Cl-c1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$ R^5	R^4 $(CH_2)_q$		
1428	<chem>Cl-c1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$ R^5	R^4 $(CH_2)_q$		
1429	<chem>H3CCH2O-c1ccc(cc1)CH2-</chem>	$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$ R^5	R^4 $(CH_2)_q$		
1430		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$ R^5	R^4 $(CH_2)_q$		

Table 1.13.1

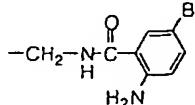
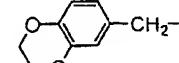
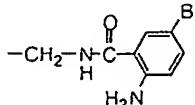
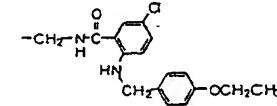
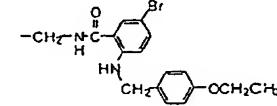
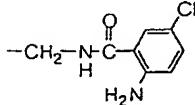
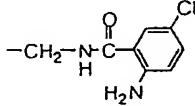
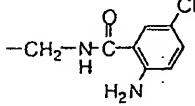
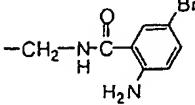
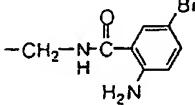
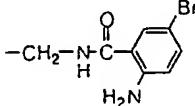
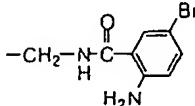
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}(\text{CH}_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^5 $\text{C}(\text{CH}_2)_q$ $\text{G}-\text{R}^6$
1431	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1432		2	2	1	-	H	
1433	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1434	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1435	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1436	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1437	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1438	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1439	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1440	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1441	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	

Table 1.132

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_k\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
1442	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1443	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CH---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1444	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{O---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1445	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1446	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CH---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1447	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{O---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1448	$\text{H}_3\text{CS---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1449	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1450	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CH---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1451	$(\text{H}_3\text{CCH}_2)_2\text{N---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1452	$\text{H}_3\text{CO---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	

Table 1.133

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}R^4\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1453	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{O}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CF}_3$
1454	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{O}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CF}_3$
1455	$\text{H}_3\text{CO}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CF}_3$
1456	$\text{O}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CF}_3$
1457	$(\text{CH}_3)_2\text{N}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{N}_2\text{Cl}$
1458	$\text{H}_3\text{CO}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{N}_2\text{Cl}$
1459	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{N}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{N}_2\text{Br}$
1460	$\text{H}_3\text{CO}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{N}_2\text{Br}$
1461	$\text{H}_3\text{CO}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{OCH}_3$
1462	$\text{H}_3\text{CO}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{OCH}_3$
1463	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	1	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}^{\text{H}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CF}_3$

Table 1.134

Compd. No.	R^1 R^2 - $(\text{CH}_2)_j$ -	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^5 - $(\text{CH}_2)_q$ - $\text{G}-\text{R}^6$
1464		2	1	1	-	H	
1465		2	1	1	-	H	
1466		2	1	1	-	H	
1467		2	1	1	-	H	
1468		2	1	1	-	H	
1469		2	1	1	-	H	
1470		2	1	1	-	H	
1471		2	1	1	-	H	
1472		1	2	0	R	H	
1473		1	2	0	R	H	
1474		1	2	0	R	H	

Table 1.135

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2-(CH_2)_j- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
1475		1	2	0	R	H	
1476		1	2	0	R	H	
1477		1	2	0	R	H	
1478		1	2	0	R	H	
1479		1	2	0	R	H	
1480		1	2	0	R	H	
1481		1	2	0	R	H	
1482		1	2	0	R	H	
1483		1	2	0	R	H	
1484		1	2	0	R	H	
1485		1	2	0	R	H	

Table 1.136

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1486	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
1487	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
1488	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_3\text{H}_5$
1489	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_4\text{H}_8$
1490	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
1491	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_3\text{H}_5-\text{NH}_2$
1492	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{NO}_2$
1493	$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_3$
1494	$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_3$
1495	$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_3$
1496	$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_3$

Table 1.137

Compd. No.	R^1 R^2	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p^{\text{R}^4} \text{R}^5 (\text{CH}_2')_q^- \text{G}-\text{R}^6$
1497			1	2	0	R	H	
1498			1	2	0	R	H	
1499			1	2	0	R	H	
1500			1	2	0	R	H	
1501			1	2	0	R	H	
1502			1	2	0	R	H	
1503			1	2	0	R	H	
1504			1	2	0	R	H	
1505			1	2	0	R	H	
1506			2	1	1	-	H	
1507			2	1	1	-	H	

Table 1.138

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1508	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	1	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-\text{N}_2$
1509	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	1	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Ph}$
1510	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	1	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Ph}$
1511	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	1	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_2(\text{Br})-\text{S}$
1512	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	1	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2-\text{N}_2$
1513	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	1	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{S}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
1514	$(\text{H}_3\text{CCH}_2)_2\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2-\text{N}_2$
1515	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OH})_2-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2-\text{N}_2$
1516	$(\text{H}_3\text{CCH}_2)_2\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})_2-\text{N}_2$
1517	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OH})_2-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})_2-\text{N}_2$
1518	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OH})_2-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2-\text{NH}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OH})_2-\text{OC}_2\text{H}_5$

Table 1.139

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
1519		2	2	1	-	H	
1520		1	2	0	R	H	
1521		1	2	0	R	H	
1522		1	2	0	R	H	
1523		1	2	0	R	H	
1524		1	2	0	R	H	
1525		1	2	0	R	H	
1526		1	2	0	R	H	
1527		1	2	0	R	H	
1528		1	2	0	R	H	
1529		1	2	0	R	H	

Table 1.140

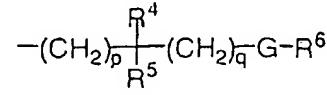
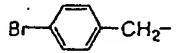
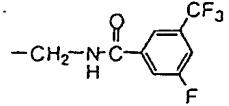
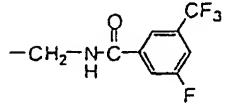
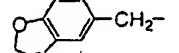
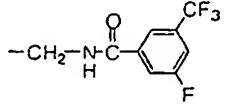
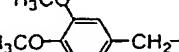
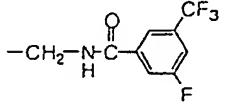
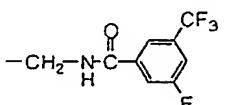
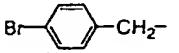
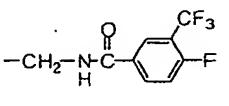
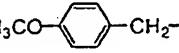
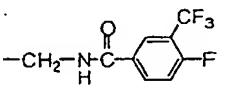
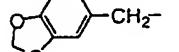
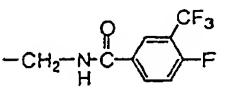
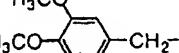
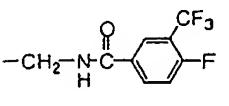
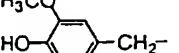
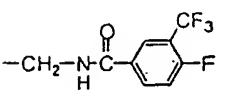
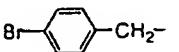
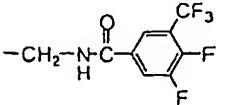
Compd. No.		k	m	n	chirality	R ³	
1530		1	2	0	R	H	
1531		1	2	0	R	H	
1532		1	2	0	R	H	
1533		1	2	0	R	H	
1534		1	2	0	R	H	
1535		1	2	0	R	H	
1536		1	2	0	R	H	
1537		1	2	0	R	H	
1538		1	2	0	R	H	
1539		1	2	0	R	H	
1540		1	2	0	R	H	

Table 1.141

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---} (CH_2)_l \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \text{---} \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1541	$\text{H}_3\text{CO} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2 \text{---} \text{CF}_3$
1542	$\text{O} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2 \text{---} \text{CF}_3$
1543	$\text{H}_3\text{CO} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{C} \text{---} \text{H}_2$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2 \text{---} \text{CF}_3$
1544	$\text{H}_3\text{CO} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2 \text{---} \text{CF}_3$
1545	$\text{Cl} \text{---} \text{S} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_5$
1546	$\text{H}_3\text{CO} \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_5$
1547	$\text{H}_3\text{CO} \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})_2 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_5$
1548	$\text{H}_3\text{C} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_3(\text{CH}_3)_2$
1549	$\text{H}_3\text{C} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_3(\text{CH}_3)_2$
1550	$\text{H}_3\text{C} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)(\text{HN---C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2 \text{---} \text{OCH}_3)$
1551	$\text{H}_3\text{C} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_5 \text{---} \text{O---S---N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH})_2$

Table 1.142

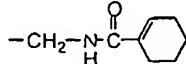
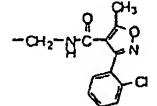
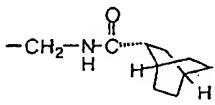
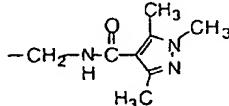
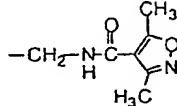
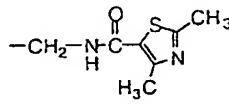
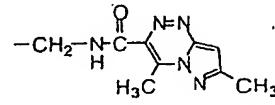
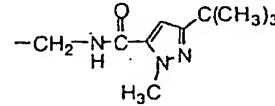
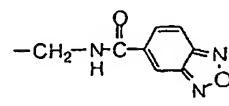
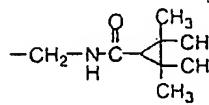
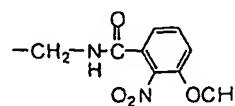
Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4	R^5	R^6		
	$\text{--}(\text{CH}_2)_p\text{--}$	$\text{--}(\text{CH}_2)_q\text{--}$	G				
1552	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1553	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1554	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1555	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1556	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1557	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1558	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1559	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1560	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1561	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1562	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	

Table 1.143

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\overset{R^4}{\text{C}}}{\underset{\underset{R^5}{\text{H}}}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1563	$\text{H}_3\text{C}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{H}}{\text{C}}}{\underset{\underset{\text{Cl}}{\text{O}}}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1564	$\text{H}_3\text{C}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{H}}{\text{C}}}{\underset{\underset{\text{CF}_3}{\text{O}}}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1565	CH_3 $\text{N}=\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_2\text{---})\text{---}=\text{O}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{H}}{\text{C}}}{\underset{\underset{\text{H}_3\text{CO}}{\text{O}}}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1566	CH_3 $\text{N}=\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_2\text{---})\text{---}=\text{O}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{H}}{\text{C}}}{\underset{\underset{\text{O}_2\text{N}}{\text{O}}}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1567	CH_3 $\text{N}=\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_2\text{---})\text{---}=\text{O}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{H}}{\text{C}}}{\underset{\underset{\text{Cl}}{\text{O}}}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1568	CH_3 $\text{N}=\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_2\text{---})\text{---}=\text{O}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{H}}{\text{C}}}{\underset{\underset{\text{CF}_3}{\text{O}}}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1569	CH_3 $\text{N}=\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_2\text{---})\text{---}=\text{O}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{H}}{\text{C}}}{\underset{\underset{\text{Cl}}{\text{O}}}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1570	$\text{H}_3\text{CS}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{H}}{\text{C}}}{\underset{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{O}}}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1571	$\text{H}_3\text{CS}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{H}}{\text{C}}}{\underset{\underset{\text{CH}_2\text{---SCH}_3}{\text{O}}}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1572	$\text{C}_6\text{H}_5\text{---}\text{N}=\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{H}}{\text{C}}}{\underset{\underset{\text{CF}_3}{\text{O}}}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1573	$\text{H}_3\text{CO}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{N}=\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{H}}{\text{C}}}{\underset{\underset{\text{CF}_3}{\text{O}}}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$

Table 1.144

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_l -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
1574	<chem>CC1=CC=C(C=C1)Nc2ccc(cc2)C(=O)Nc3ccc(cc3)CCl</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1575	<chem>CC1=CC=C(C=C1)Nc2ccc(cc2)C(=O)Nc3ccc(cc3)Cl</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1576	<chem>CC1=CC=C(C=C1)Nc2ccc(cc2)C(=O)Nc3ccccc3</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1577	<chem>CC1=CC=C(C=C1)Nc2ccc(cc2)C(=O)Nc3ccccc3O</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1578	<chem>CC1=CC=C(C=C1)Nc2ccc(cc2)C(=O)Nc3ccc(cc3)C(F)(F)F</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1579	<chem>CC1=CC=C(C=C1)Nc2ccc(cc2)C(=O)Nc3ccc(cc3)C(F)(F)F</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1580	<chem>CC1=CC=C(C=C1)Nc2ccc(cc2)C(=O)Nc3ccccc3</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1581	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C(F)(F)F</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1582	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C(F)(F)F</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1583	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C(F)(F)F</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)N</chem>
1584	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C(F)(F)F</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)NOC(F)(F)F</chem>

Table 1.145

Compd. No.	R^1 R^2	R^3	k	m	n	chirality	R^4 R^5	$-(\text{CH}_2)_p(\text{CH}_2)_q\text{G}-\text{R}^6$
1585	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})\text{N}$
1586	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})\text{N}$
1587	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_5$
1588	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)\text{N}$
1589	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)\text{N}$
1590	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCF}_3)\text{N}$
1591	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})\text{N}$
1592	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})\text{N}$
1593	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_5$
1594	$\text{CH}_3-\text{C}_3\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)\text{N}$
1595	$\text{CH}_3-\text{C}_3\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCF}_3)\text{N}$

Table 1.146

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
1596		1	2	0	R	H	
1597		1	2	0	R	H	
1598		1	2	0	R	H	
1599		1	2	0	R	H	
1600		2	2	1	-	H	
1601		2	2	1	-	H	
1602		2	2	1	-	H	
1603		2	2	1	-	H	
1604		2	2	1	-	H	
1605		2	2	1	-	H	
1606		1	2	0	R	H	

Table 1.147

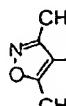
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(CH_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}$ $-(CH_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1607	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---SCF}_3$
1608	CH_3 	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---SCF}_3$
1609	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---SCF}_3$
1610	CF_3 	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
1611	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
1612	$\text{H}_3\text{CO}(\text{CH}_2)_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
1613	$\text{H}_3\text{O---C}_6\text{H}_4\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
1614	$\text{F}_3\text{CS---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
1615	$\text{F}_3\text{CS---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
1616	$\text{F}_3\text{CS---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---Cl}$ H_2N
1617	$\text{F}_3\text{CS---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---Br}$ H_2N

Table 1.148

Compd. No.	R^1 R^2	$\geq (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ $\overset{R^4}{\underset{R^5}{\lvert}} (CH_2)_q G - R^6$
1618		$\geq (CH_2)_j$	1	2	0	R	H	
1619		$\geq (CH_2)_j$	1	2	0	R	H	
1620		$\geq (CH_2)_j$	1	2	0	R	H	
1621		$\geq (CH_2)_j$	1	2	0	R	H	
1622		$\geq (CH_2)_j$	1	2	0	R	H	
1623		$\geq (CH_2)_j$	1	2	0	R	H	
1624		$\geq (CH_2)_j$	1	2	0	R	H	
1625		$\geq (CH_2)_j$	1	2	0	R	H	
1626		$\geq (CH_2)_j$	1	2	0	R	H	
1627		$\geq (CH_2)_j$	1	2	0	R	H	
1628		$\geq (CH_2)_j$	1	2	0	R	H	

Table 1.149

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\begin{array}{c} R^4 \\ \\ \text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6 \\ \\ R^5 \end{array}$
1629	$\text{H}_3\text{CS---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}(\text{H})\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
1630	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_3\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}(\text{H})\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
1631	$\text{H}_2\text{NCH}_2\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}(\text{H})\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
1632	$\text{CF}_3\text{---C}_6\text{H}_3\text{---N---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}(\text{H})\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
1633	$\text{H}_3\text{CS---C}_6\text{H}_3\text{---N---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}(\text{H})\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
1634	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CH---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}(\text{H})\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
1635	$\text{H}_3\text{C---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}(\text{H})\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---C}(\text{CH}_3)_3$
1636	$\text{H}_3\text{C---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}(\text{H})\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---C}(\text{CH}_3)_2\text{---CH}_3$
1637	$\text{CH}_3\text{---O---C}_6\text{H}_3\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}(\text{H})\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---(CH}_2)_4\text{CH}_3$
1638	$\text{CH}_3\text{---O---C}_6\text{H}_3\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}(\text{H})\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---O(CH}_2)_3\text{CH}_3$
1639	$\text{CH}_3\text{---O---C}_6\text{H}_3\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---N}(\text{H})\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---N}(\text{H})\text{---C}(=\text{O})\text{---OCH}_2\text{CH}_3$

Table 1.150

Compd. No.	R^1 R^2 - (CH_2) _j -	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ R^4 R^5 - (CH_2) _q - G-R ⁶
1640		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}-(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$
1641		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCF}_2\text{CHClF}$
1642		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{O}_2\text{N})-\text{C}_6\text{H}_5$
1643		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
1644		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
1645		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1646		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1647	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1648	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1649	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1650	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$

Table 1.151

Compd. No.	R^1 $\begin{array}{c} \nearrow \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1651	$H_3C(CH_2)_3 - \begin{array}{c} \text{Br} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 -$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2 - \begin{array}{c} \text{Br} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - (CH_2)_3 C H_3$
1652	$H_3C(CH_2)_3 - \begin{array}{c} \text{Br} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 -$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2 - \begin{array}{c} \text{Br} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 - \text{NH}_2$
1653	$H_3C(CH_2)_2 - \begin{array}{c} \text{Br} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 -$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2 - \begin{array}{c} \text{Br} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_3$
1654	$H_3C(CH_2)_2 - \begin{array}{c} \text{Br} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 -$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2 - \begin{array}{c} \text{Br} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 - \text{NH}_2$
1655	$H_3C(CH_2)_3 - \begin{array}{c} \text{Cl} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 -$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2 - \begin{array}{c} \text{Cl} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_3$
1656	$H_3C(CH_2)_3 - \begin{array}{c} \text{Cl} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 -$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2 - \begin{array}{c} \text{Cl} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 - \text{NH}_2$
1657	$H_3C(CH_2)_2 - \begin{array}{c} \text{Cl} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 -$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2 - \begin{array}{c} \text{Cl} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_3$
1658	$H_3C(CH_2)_2 - \begin{array}{c} \text{Cl} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 -$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2 - \begin{array}{c} \text{Cl} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 - \text{NH}_2$
1659	$Cl - \text{C}_6\text{H}_4 - \text{CH}_2 -$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2 - \begin{array}{c} \text{Cl} \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 - \text{NH}_2$
1660	$Br - \text{C}_6\text{H}_4 - \text{CH}_2 -$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 - \begin{array}{c} \text{CF}_3 \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 - \text{NH}_2$
1661	$Br - \text{C}_6\text{H}_4 - \text{CH}_2 -$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 - \begin{array}{c} \text{OCF}_3 \\ \text{O} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array} - \text{C}_6\text{H}_3 - \text{CH}_2 - \text{NH}_2$

Table 1.152

Compd. No.	R^1 R^2	$(CH_2)_i$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\ \\ -(CH_2)_q \\ \\ R^5 \end{array}$ G-R ⁶
1662	Br- 	CH_2-	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-\text{N}_2$
1663	Br- 	CH_2-	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})-\text{N}_2$
1664	$\text{H}_3\text{CS}-$ 	CH_2-	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)-\text{N}_2$
1665	$\text{H}_3\text{CS}-$ 	CH_2-	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCF}_3)-\text{N}_2$
1666	$\text{H}_3\text{CS}-$ 	CH_2-	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})-\text{N}_2$
1667	H_3CCH_2- 	CH_2-	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})$
1668	H_3CCH_2- 	CH_2-	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})-\text{N}_2$
1669	H_3CCH_2- 	CH_2-	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})-\text{N}_2$
1670	H_3CCH_2- 	CH_2-	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})-\text{N}_2$
1671	H_3CCH_2- 	CH_2-	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCF}_3)-\text{N}_2$
1672	H_3CCH_2- 	CH_2-	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)-\text{N}_2$

Table 1.153

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_i\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\begin{array}{c} \text{R}^4 \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{R}^5 \end{array}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
1673	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}(\text{H})\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})_2\text{---}\text{Cl}$
1674	$\text{F---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}(\text{H})\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})_2\text{---}\text{O}$
1675	$\text{F---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}(\text{H})\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2\text{---}\text{H}_2\text{N}$
1676	$\text{F---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}(\text{H})\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{H}_2\text{N}$
1677	$\text{F---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}(\text{H})\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{H}_2\text{N}$
1678	$\text{F---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}(\text{H})\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2\text{---}\text{H}_2\text{N}$
1679	$\text{F---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}(\text{H})\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{Cl---H}_2\text{N}$
1680	$\text{F---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}(\text{H})\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{OCF}_3\text{---H}_2\text{N}$
1681	$\text{F---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}(\text{H})\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{CF}_3\text{---H}_2\text{N}$
1682	$\text{F---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}(\text{H})\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{Cl---Br}$
1683	$\text{C}_6\text{H}_5\text{---N}(\text{H})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\text{N}(\text{H})\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})_2\text{---}\text{O}$

Table 1.154

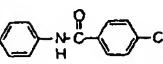
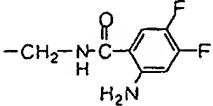
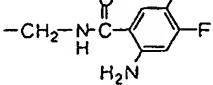
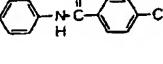
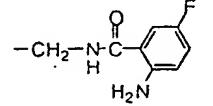
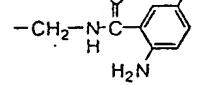
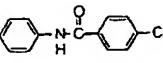
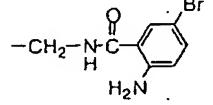
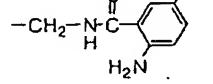
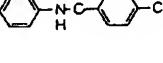
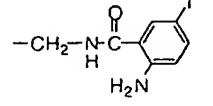
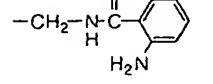
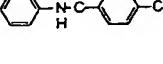
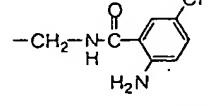
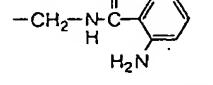
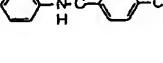
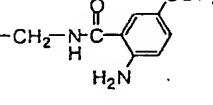
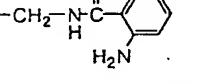
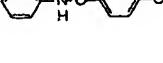
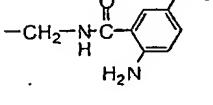
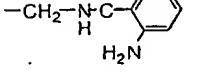
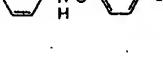
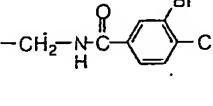
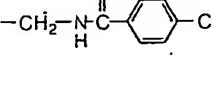
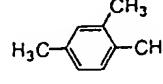
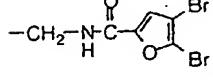
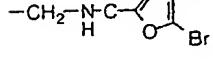
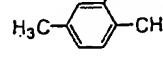
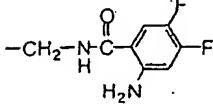
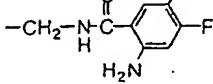
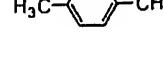
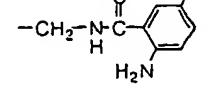
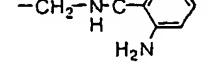
Compd. No.	R^1 R^2	$(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ R^5	$(\text{CH}_2)_q$	$\text{G}-\text{R}^6$
1684		$(\text{CH}_2)_2^-$	2	2	1	-	H			
1685		$(\text{CH}_2)_2^-$	2	2	1	-	H			
1686		$(\text{CH}_2)_2^-$	2	2	1	-	H			
1687		$(\text{CH}_2)_2^-$	2	2	1	-	H			
1688		$(\text{CH}_2)_2^-$	2	2	1	-	H			
1689		$(\text{CH}_2)_2^-$	2	2	1	-	H			
1690		$(\text{CH}_2)_2^-$	2	2	1	-	H			
1691		$(\text{CH}_2)_2^-$	2	2	1	-	H			
1692		$(\text{CH}_2)_1^-$	1	2	0	R	H			
1693		$(\text{CH}_2)_1^-$	1	2	0	R	H			
1694		$(\text{CH}_2)_1^-$	1	2	0	R	H			

Table 1.155

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1695		1	2	0	R	H	
1696		1	2	0	R	H	
1697		1	2	0	R	H	
1698		1	2	0	R	H	
1699		1	2	0	R	H	
1700		1	2	0	R	H	
1701		1	2	0	R	H	
1702		1	2	0	R	H	
1703		1	2	0	R	H	
1704		1	2	0	R	H	
1705		1	2	0	R	H	

Table 1.156

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1706		1	2	0	R	H	
1707		1	2	0	R	H	
1708		1	2	0	R	H	
1709		1	2	0	R	H	
1710		1	2	0	R	H	
1711		1	2	0	R	H	
1712		1	2	0	R	H	
1713		1	2	0	R	H	
1714		1	2	0	R	H	
1715		1	2	0	R	H	
1716		1	2	0	R	H	

Table 1.157

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{array}{c} R^4 \\ \\ \text{---} \text{C} \text{---} \\ \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1717		1	2	0	R	H	
1718		1	2	0	R	H	
1719		1	2	0	R	H	
1720		1	2	0	R	H	
1721		1	2	0	R	H	
1722		1	2	0	R	H	
1723		1	2	0	R	H	
1724		1	2	0	R	H	
1725		1	2	0	R	H	
1726		1	2	0	R	H	
1727		1	2	0	R	H	

177

Table 1.158

Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4 R^5 R^6
	$\text{CH}_2\text{--}$	H	$-(\text{CH}_2)_p(\text{CH}_2)_q\text{--G--R}^6$
	$\text{CH}_2\text{--}$	H	$-(\text{CH}_2)_p(\text{CH}_2)_q\text{--G--R}^6$
1728		1 2 0 R	H
1729		1 2 0 R	H
1730		1 2 0 R	H
1731		1 2 0 R	H
1732		1 2 0 R	H
1733		1 2 0 R	H
1734		1 2 0 R	H
1735		1 2 0 R	H
1736		1 2 0 R	H
1737		1 2 0 R	H
1738		1 2 0 R	H

Table 1.159

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---R}^6$
1739	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2\text{---CH}_2\text{---}$
1740		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{Br}\text{---CH}_2\text{---}$
1741	$\text{H}_3\text{CS---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{Br}\text{---CH}_2\text{---}$
1742	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{Br}\text{---CH}_2\text{---}$
1743		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{Br}\text{---CH}_2\text{---}$
1744	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_3\text{CH}_2\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{Br}\text{---CH}_2\text{---}$
1745	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_2\text{CH}_2\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{Br}\text{---CH}_2\text{---}$
1746	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{Br}\text{---CH}_2\text{---}$
1747		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{NH}_2\text{---CH}_2\text{---}$
1748	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{NH}_2\text{---CH}_2\text{---}$
1749	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_3\text{CH}_2\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{NH}_2\text{---CH}_2\text{---}$

Table 1.160

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2- \\ \\ (CH_2)_n- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
1750		1	2	0	R	H	
1751		1	2	0	R	H	
1752		1	2	0	R	H	
1753		1	2	0	R	H	
1754		1	2	0	R	H	
1755		1	2	0	R	H	
1756		1	2	0	R	H	
1757		1	2	0	R	H	
1758		1	2	0	R	H	
1759		1	2	0	R	H	
1760		1	2	0	R	H	

Table 1.161

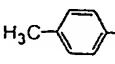
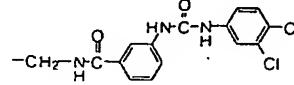
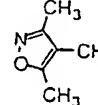
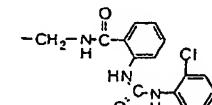
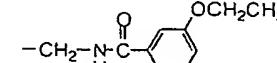
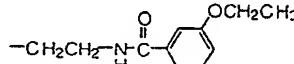
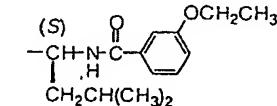
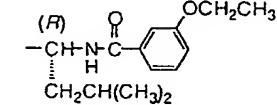
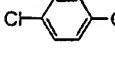
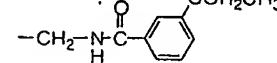
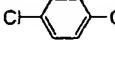
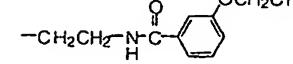
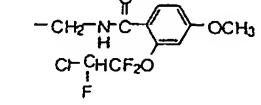
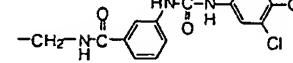
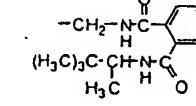
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\overset{R^4}{ }}{\underset{R^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1761		1	2	0	R	H	
1762		1	2	0	R	H	
1763		2	2	0	-	H	
1764		2	2	0	-	H	
1765		2	2	0	-	H	
1766		2	2	0	-	H	
1767		1	3	1	-	H	
1768		1	3	1	-	H	
1769		1	2	0	R	H	
1770		1	2	0	R	H	
1771		1	2	0	R	H	

Table 1.16.2

Compd. No.	R^1 R^2	$(CH_2)_l^-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p^-\overset{R^4}{C}(CH_2)_q^-G-R^6$
1772		CH_2^-	1	2	0	R	H	
1773		CH_2^-	1	2	0	R	H	
1774		CH_2^-	1	2	0	R	H	
1775		CH_2^-	1	2	0	R	H	
1776		CH_2^-	1	2	0	R	H	
1777		CH_2^-	2	2	1	-	H	
1778		CH_2^-	2	2	1	-	H	
1779		CH_2^-	2	2	1	-	H	
1780		CH_2^-	2	2	1	-	H	
1781		CH_2^-	2	2	1	-	H	
1782		CH_2^-	2	2	1	-	H	

182

Table 1.163

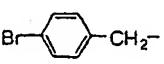
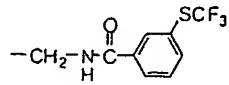
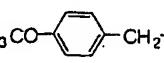
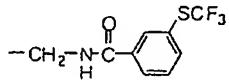
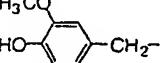
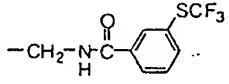
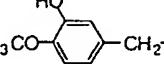
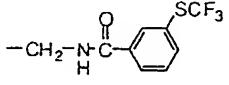
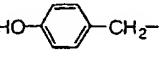
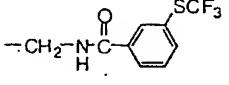
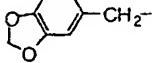
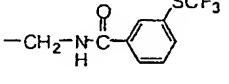
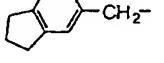
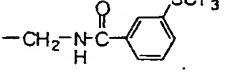
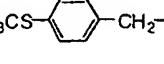
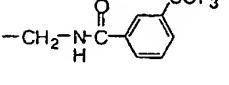
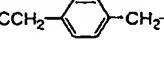
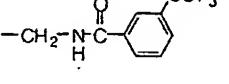
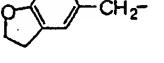
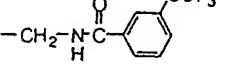
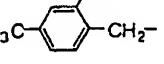
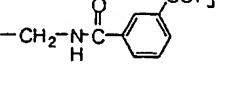
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1783	<chem>NCc1ccc(cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)N(C(F)(F)F)N</chem>
1784	<chem>c1ccccc1C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)N(C(F)(F)F)N</chem>
1785	<chem>CC(C)Cc1ccc(cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)N(C(F)(F)F)N</chem>
1786	<chem>c1ccc2c(c1)ccc2C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)N(C(F)(F)F)N</chem>
1787	<chem>CC(C)Cc1ccc(cc1)C</chem>	1	2	0	R	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)N(C(F)(F)F)N</chem>
1788	<chem>CC(C)c1ccc(cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)N(C(F)(F)F)N</chem>
1789	<chem>CCOCc1ccc(cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)N(C(F)(F)F)N</chem>
1790	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)N(C(F)(F)F)N</chem>
1791	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)N(C(F)(OC(F)(F)F)F)N</chem>
1792	<chem>CC(C)c1ccc(cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)N(C(F)(F)F)N</chem>
1793	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>CC(=O)c1ccc(cc1)N(C(F)(F)F)N</chem>

Table 1.164

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\overset{\substack{R^4 \\ \\ R^5}}{\underset{\substack{ \\ }}{\text{---}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1794	$\text{H}_3\text{C}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ \\ \text{H}}}{\text{N}}\text{---}\overset{\substack{\text{C} \\ \\ \text{H}_2\text{N}}}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2$
1795	$\text{O}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{O}\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ \\ \text{H}}}{\text{N}}\text{---}\overset{\substack{\text{C} \\ \\ \text{H}_2\text{N}}}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2$
1796	$\text{Br}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ \\ \text{H}}}{\text{N}}\text{---}\overset{\substack{\text{C} \\ \\ \text{H}_2\text{N}}}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2$
1797	$\text{HO}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ \\ \text{H}}}{\text{N}}\text{---}\overset{\substack{\text{C} \\ \\ \text{H}_2\text{N}}}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2$
1798	$\text{H}_3\text{CO}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ \\ \text{H}}}{\text{N}}\text{---}\overset{\substack{\text{C} \\ \\ \text{H}_2\text{N}}}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2$
1799	$\text{H}_2\text{C}\text{---}\overset{\substack{\text{C} \\ \\ \text{H}_2\text{C}}}{\text{CH}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ \\ \text{H}}}{\text{N}}\text{---}\overset{\substack{\text{C} \\ \\ \text{H}_2\text{N}}}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2$
1800	$\text{NC}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ \\ \text{H}}}{\text{N}}\text{---}\overset{\substack{\text{C} \\ \\ \text{H}_2\text{N}}}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2$
1801	$\text{C}_6\text{H}_5\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ \\ \text{H}}}{\text{N}}\text{---}\overset{\substack{\text{C} \\ \\ \text{H}_2\text{N}}}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2$
1802	$\text{HO}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$ $\text{H}_3\text{CCH}_2\text{O}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ \\ \text{H}}}{\text{N}}\text{---}\overset{\substack{\text{C} \\ \\ \text{H}_2\text{N}}}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{CF}_3$
1803	$\text{HO}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$ H_3C	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ \\ \text{H}}}{\text{N}}\text{---}\overset{\substack{\text{C} \\ \\ \text{H}_2\text{N}}}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{CF}_3$
1804	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\substack{\text{O} \\ \\ \text{H}}}{\text{N}}\text{---}\overset{\substack{\text{C} \\ \\ \text{H}_2\text{N}}}{\text{C}}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{F}_2$

184

Table 1.165

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\begin{array}{c} R^4 \\ \\ \text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6 \end{array}$
1805		1	2	0	R	H	
1806		1	2	0	R	H	
1807		1	2	0	R	H	
1808		1	2	0	R	H	
1809		1	2	0	R	H	
1810		1	2	0	R	H	
1811		1	2	0	R	H	
1812		1	2	0	R	H	
1813		1	2	0	R	H	
1814		1	2	0	R	H	
1815		1	2	0	R	H	

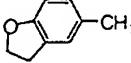
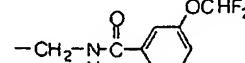
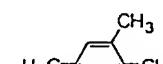
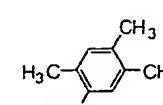
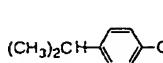
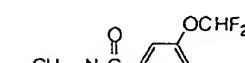
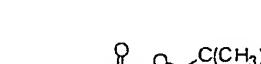
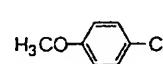
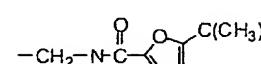
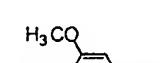
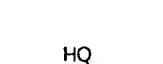
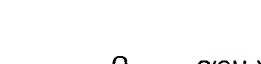
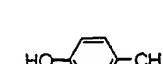
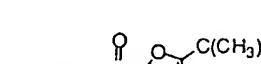
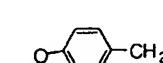
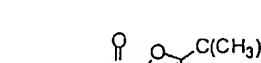
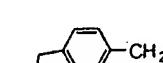
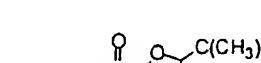
185

Table 1.166

Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4	R^5	R^6		
	$\text{--}(\text{CH}_2)_p\text{--}$	k	m	n	chirality	$\text{--}(\text{CH}_2)_p\text{--}$	G--R^6
1816	$(\text{CH}_3)_2\text{CH--}\text{C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	$\text{--CH}_2\text{--N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--SCF}_3$
1817	$(\text{CH}_3)_3\text{C--}\text{C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	$\text{--CH}_2\text{--N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--SCF}_3$
1818	$\text{Br--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	$\text{--CH}_2\text{--N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--OCHF}_2$
1819	$\text{H}_3\text{CO--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	$\text{--CH}_2\text{--N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--OCHF}_2$
1820	$\text{HO--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	$\text{--CH}_2\text{--N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--OCHF}_2$
1821	$\text{H}_3\text{CO--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	$\text{--CH}_2\text{--N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--OCHF}_2$
1822	$\text{HO--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	$\text{--CH}_2\text{--N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--OCHF}_2$
1823	$\text{O--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	$\text{--CH}_2\text{--N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--OCHF}_2$
1824	$\text{C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	$\text{--CH}_2\text{--N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--OCHF}_2$
1825	$\text{H}_3\text{CS--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	$\text{--CH}_2\text{--N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--OCHF}_2$
1826	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	$\text{--CH}_2\text{--N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{--C}_6\text{H}_4\text{--OCHF}_3$

Table 1.167

186

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1827		1	2	0	R	H	
1828		1	2	0	R	H	
1829		1	2	0	R	H	
1830		1	2	0	R	H	
1831		1	2	0	R	H	
1832		1	2	0	R	H	
1833		1	2	0	R	H	
1834		1	2	0	R	H	
1835		1	2	0	R	H	
1836		1	2	0	R	H	
1837		1	2	0	R	H	

187

Table 1.168

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_i\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\begin{array}{c} \text{R}^4 \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{H} \end{array}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
1838	$\text{H}_3\text{CS---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{N---C} \\ \\ \text{H} \end{array}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---C}(\text{CH}_3)_3$
1839	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{N---C} \\ \\ \text{H} \end{array}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---C}(\text{CH}_3)_3$
1840	$\text{O---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{N---C} \\ \\ \text{H} \end{array}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---C}(\text{CH}_3)_3$
1841	$\text{H}_3\text{C---C}_6\text{H}_3\text{CH}_3\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{N---C} \\ \\ \text{H} \end{array}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{CH}_3\text{---C}(\text{CH}_3)_3$
1842	$\text{H}_3\text{C---C}_6\text{H}_2\text{CH}_3\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{N---C} \\ \\ \text{H} \end{array}\text{---}\text{C}_6\text{H}_2\text{CH}_3\text{---C}(\text{CH}_3)_3$
1843	$(\text{CH}_3)_2\text{CH---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{N---C} \\ \\ \text{H} \end{array}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---C}(\text{CH}_3)_3$
1844	$(\text{CH}_3)_3\text{C---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{N---C} \\ \\ \text{H} \end{array}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---C}(\text{CH}_3)_3$
1845	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{N---C} \\ \\ \text{H} \end{array}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---C}_6\text{H}_3\text{Br---CH}_2\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{CH}_3$
1846	$\text{H}_3\text{C---C}_6\text{H}_3\text{CH}_3\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{N---C} \\ \\ \text{H} \end{array}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{CH}_3\text{---SCF}_3$
1847	$(\text{CH}_3)_3\text{C---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{N---C} \\ \\ \text{H} \end{array}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---OCCH}_2\text{F}_2$
1848	$\text{H}_3\text{CO---C}_6\text{H}_3\text{OH---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{N---C} \\ \\ \text{H} \end{array}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3\text{OH---C}_6\text{H}_5$

Table 1.169

188

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\substack{R^4 \\ }}{\underset{R^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1849		1	2	0	R	H	
1850	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
1851		1	2	0	R	H	
1852		1	2	0	R	H	
1853		1	2	0	R	H	
1854		1	2	0	R	H	
1855	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
1856		1	2	0	R	H	
1857		1	2	0	R	H	
1858		1	2	0	R	H	
1859		1	2	0	R	H	

Table 1.170

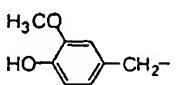
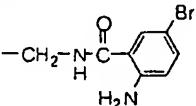
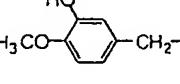
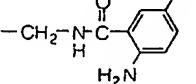
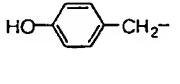
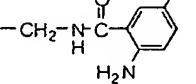
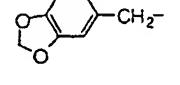
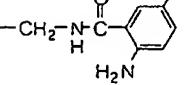
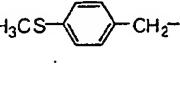
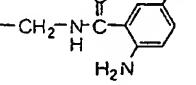
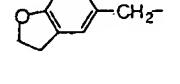
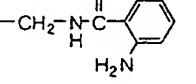
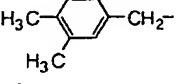
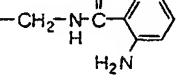
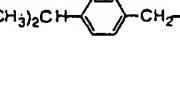
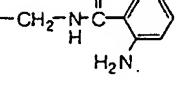
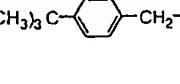
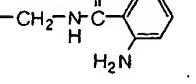
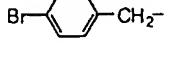
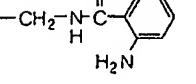
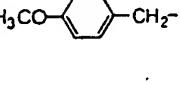
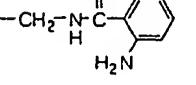
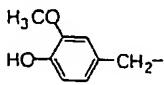
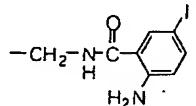
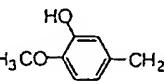
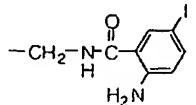
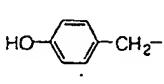
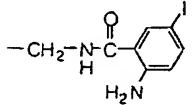
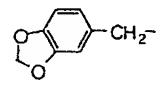
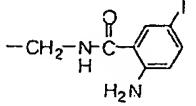
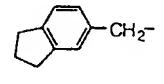
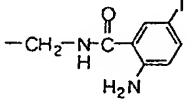
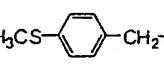
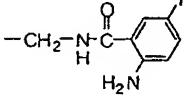
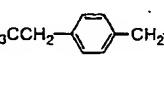
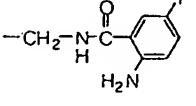
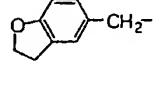
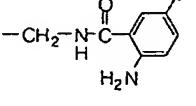
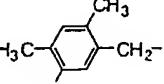
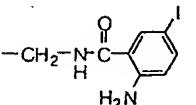
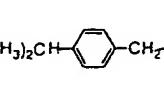
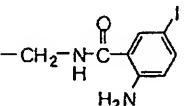
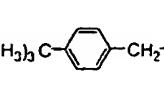
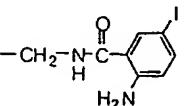
Compd. No.	R^1 R^2	R^3	R^4 R^5	R^6			
	$\text{--}(\text{CH}_2)_p\text{--}$	$\text{--}(\text{CH}_2)_q\text{--}$	G	R^6			
1860		1	2	0	R	H	
1861		1	2	0	R	H	
1862		1	2	0	R	H	
1863		1	2	0	R	H	
1864		1	2	0	R	H	
1865		1	2	0	R	H	
1866		1	2	0	R	H	
1867		1	2	0	R	H	
1868		1	2	0	R	H	
1869		1	2	0	R	H	
1870		1	2	0	R	H	

Table 1.171

190

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
1871		1	2	0	R	H	
1872		1	2	0	R	H	
1873		1	2	0	R	H	
1874		1	2	0	R	H	
1875		1	2	0	R	H	
1876		1	2	0	R	H	
1877		1	2	0	R	H	
1878		1	2	0	R	H	
1879		1	2	0	R	H	
1880		1	2	0	R	H	
1881		1	2	0	R	H	

191

Table 1.172

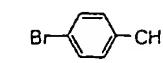
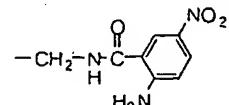
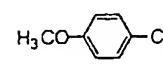
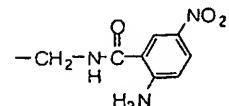
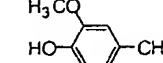
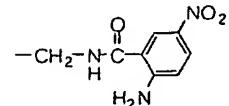
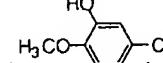
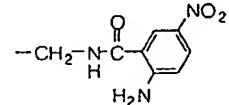
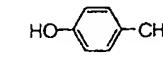
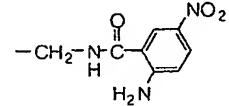
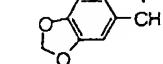
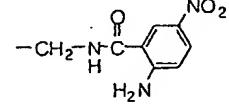
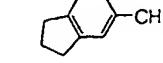
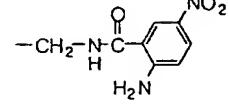
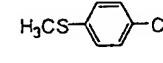
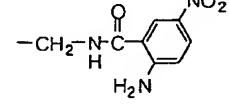
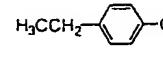
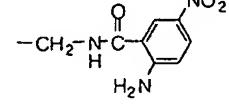
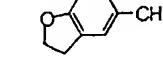
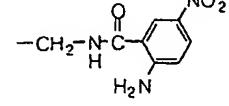
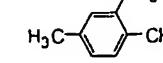
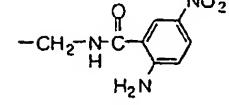
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\overset{\substack{R^4 \\ }}{\underset{\substack{R^5 \\ }}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1882		1	2	0	R	H	
1883		1	2	0	R	H	
1884		1	2	0	R	H	
1885		1	2	0	R	H	
1886		1	2	0	R	H	
1887		1	2	0	R	H	
1888		1	2	0	R	H	
1889		1	2	0	R	H	
1890		1	2	0	R	H	
1891		1	2	0	R	H	
1892		1	2	0	R	H	

Table 1.173

Compd. No.	R^1 R^2 - $\text{C}(\text{CH}_2)_j-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-$ $\text{C}(\text{R}^4)_{\text{R}^5}-$ $(\text{CH}_2)_q-$ $\text{G}-\text{R}^6$
1893		1	2	0	R	H	
1894	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1895	$(\text{CH}_3)_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1896		1	2	0	R	H	
1897	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1898	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1899	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1900		1	2	0	R	H	
1901	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1902		1	2	0	R	H	
1903	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	

193

Table 1.174

Compd. No.	R^1 R^2	R^3	k	m	n	chirality	R^4 R^5	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1904	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCF}_3$
1905	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{Cl}$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCF}_3$
1906	$\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCF}_3$
1907	$\text{HO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCF}_3$
1908	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCF}_3$
1909	$\text{H}_2\text{C}=\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCF}_3$
1910	$\text{Br}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCF}_3$
1911	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCF}_3$
1912	$\text{HO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCF}_3$
1913	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{CH}_3$	H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCF}_3$
1914	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCF}_3$

Table 1.175

Compd. No.	R_1^1 R_2^2 $\text{---} (\text{CH}_2)_l \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p \overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{---}}} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1915		1	2	0	R	H	
1916		1	2	0	R	H	
1917		2	2	1	-	H	
1918		2	2	1	-	H	
1919		2	2	1	-	H	
1920		2	2	1	-	H	
1921		1	2	0	R	H	
1922		2	2	1	-	H	
1923		2	2	1	-	H	
1924		2	2	1	-	H	
1925		2	2	1	-	H	

Table 1.176

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p \overset{\substack{R^4 \\ }}{\underset{R^5}{\text{---}}} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1926		2	2	1	-	H	
1927		2	2	1	-	H	
1928		2	2	1	-	H	
1929		2	2	1	-	H	
1930		2	2	1	-	H	
1931		2	2	1	-	H	
1932		2	2	1	-	H	
1933		2	2	1	-	H	
1934		2	2	1	-	H	
1935		2	2	1	-	H	
1936		2	2	1	-	H	

Table 1.177

196

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}(\text{R}^1)(\text{R}^2)\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)\text{CH}_2)_q\text{G-R}^6$
1937	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{SCF}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$
1938	$\text{Br}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$
1939	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$
1940	$\text{F}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$
1941	$\text{F}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$
1942	$\text{HO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$
1943	$\text{O}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$
1944	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$
1945	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$
1946	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$
1947	$\text{O}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$

Table 1.178

197

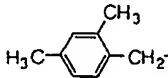
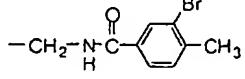
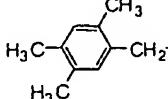
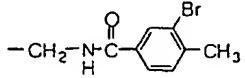
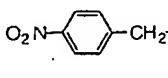
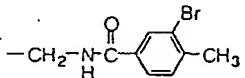
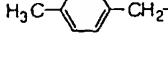
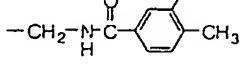
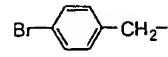
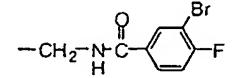
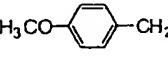
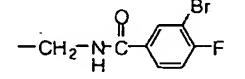
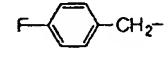
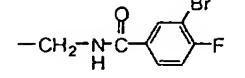
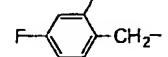
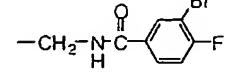
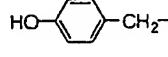
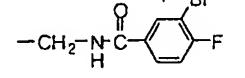
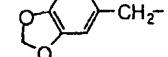
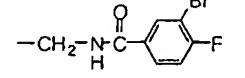
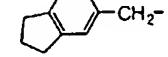
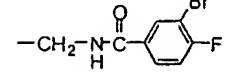
Compd. No.	R^1 R^2 — $(CH_2)_j$ —	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ R^4 R^5 — $(CH_2)_q$ —G— R^6
1948		2	2	1	-	H	
1949		2	2	1	-	H	
1950		2	2	1	-	H	
1951		2	2	1	-	H	
1952		2	2	1	-	H	
1953		2	2	1	-	H	
1954		2	2	1	-	H	
1955		2	2	1	-	H	
1956		2	2	1	-	H	
1957		2	2	1	-	H	
1958		2	2	1	-	H	

Table 1.179

198

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1959	$\text{H}_3\text{CS}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}\text{---}\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F},\text{Br})_2\text{---}$
1960	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}\text{---}\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F},\text{Br})_2\text{---}$
1961	$\text{O}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}\text{---}\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F},\text{Br})_2\text{---}$
1962	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3, \text{H})_2\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}\text{---}\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F},\text{Br})_2\text{---}$
1963	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}\text{---}\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F},\text{Br})_2\text{---}$
1964	$\text{O}_2\text{N---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}\text{---}\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F},\text{Br})_2\text{---}$
1965	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}\text{---}\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F},\text{Br})_2\text{---}$
1966	$(\text{CH}_3)_2\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}\text{---}\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F},\text{Br})_2\text{---}$
1967	$\text{Br---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{N}}}(\text{C}\text{---}\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2\text{---}$
1968	$\text{H}_3\text{CO---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{N}}}(\text{C}\text{---}\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2\text{---}$
1969	$\text{HO---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{N}}}(\text{C}\text{---}\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2\text{---}$

199

Table 1.180

Compd. No.	R^1 R^2 R^3	k	m	n	chirality	R^4 R^5	$-(\text{CH}_2)_p(\text{CH}_2)_q\text{G}-\text{R}^6$
1970		2	2	1	-	H	
1971		2	2	1	-	H	
1972	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1973	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1974		2	2	1	-	H	
1975	$\text{O}_2\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1976	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1977	$\text{NC}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1978	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1979		2	2	1	-	H	
1980		2	2	1	-	H	

200

Table 1.181

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_i\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1981	$\text{O}_2\text{N}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}N\text{---}C(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2\text{---}H_2\text{N}$
1982	$\text{NC}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}N\text{---}C(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2\text{---}H_2\text{N}$
1983	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}N\text{---}C(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2\text{---}H_2\text{N}$
1984	$\text{Br}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}N\text{---}C(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2\text{---}H_2\text{N}$
1985	$\text{H}_3\text{CO}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}N\text{---}C(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2\text{---}H_2\text{N}$
1986	$\text{HO}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}N\text{---}C(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2\text{---}H_2\text{N}$
1987	$\text{O}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})_2\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}N\text{---}C(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2\text{---}H_2\text{N}$
1988	$\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}N\text{---}C(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2\text{---}H_2\text{N}$
1989	$\text{H}_3\text{CS}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}N\text{---}C(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2\text{---}H_2\text{N}$
1990	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}N\text{---}C(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2\text{---}H_2\text{N}$
1991	$\text{O}\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})_2\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}N\text{---}C(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2\text{---}H_2\text{N}$

201

Table 1.182

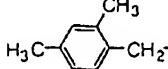
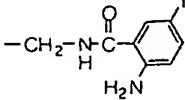
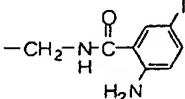
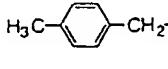
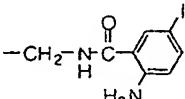
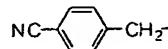
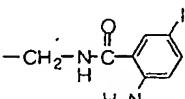
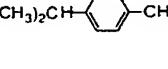
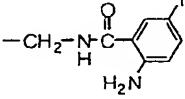
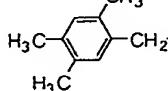
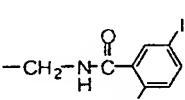
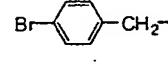
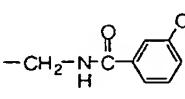
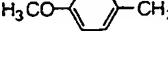
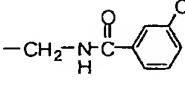
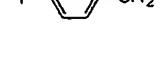
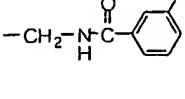
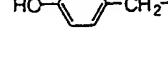
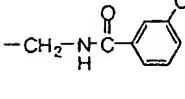
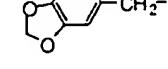
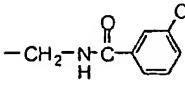
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_i\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1992		2	2	1	-	H	
1993		2	2	1	-	H	
1994		2	2	1	-	H	
1995		2	2	1	-	H	
1996		2	2	1	-	H	
1997		2	2	1	-	H	
1998		2	2	1	-	H	
1999		2	2	1	-	H	
2000		2	2	1	-	H	
2001		2	2	1	-	H	
2002		2	2	1	-	H	

Table 1.183

202

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_i\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
2003		2	2	1	-	H	
2004	$\text{H}_3\text{CS---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2005	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2006	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_3\text{CH}_3\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2007	$\text{O}_2\text{N---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2008	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2009	$\text{NC---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2010	$(\text{CH}_3)_2\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2011	$\text{H}_3\text{C---}\text{C}_6\text{H}_3\text{CH}_3\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2012	$\text{Br---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2013	$\text{H}_3\text{CO---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	

Table 1.184

Compd. No.	R^1 R^2	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}$ $-(CH_2)_q$ G-R ⁶
2014	<chem>COc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)c(Br)cc1</chem>
2015	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C2=CC=C(C=C2)OC</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)c(Br)cc1</chem>
2016	<chem>C1CCCC2=C1C=CC=C2</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)c(Br)cc1</chem>
2017	<chem>CS(=O)c1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)c(Br)cc1</chem>
2018	<chem>CCc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)c(Br)cc1</chem>
2019	<chem>C1CCCC2=C1C=CC=C2</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)c(Br)cc1</chem>
2020	<chem>CC(C)c1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)c(Br)cc1</chem>
2021	<chem>NO2c1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)c(Br)cc1</chem>
2022	<chem>CCc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)c(Br)cc1</chem>
2023	<chem>CC#Nc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)c(Br)cc1</chem>
2024	<chem>CC(C)c1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)c(Br)cc1</chem>

204

Table 1.185

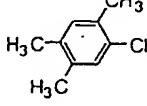
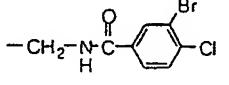
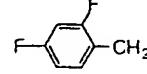
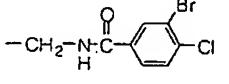
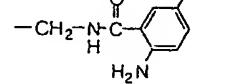
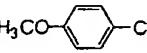
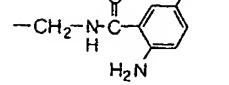
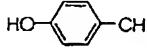
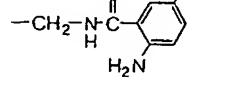
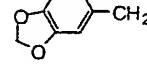
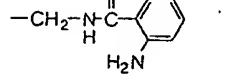
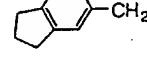
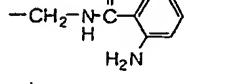
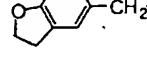
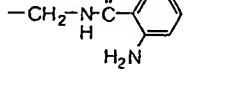
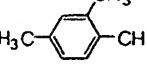
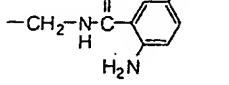
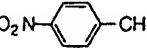
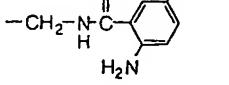
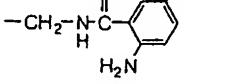
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_i\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
2025		2	2	1	-	H	
2026		2	2	1	-	H	
2027		2	2	1	-	H	
2028		2	2	1	-	H	
2029		2	2	1	-	H	
2030		2	2	1	-	H	
2031		2	2	1	-	H	
2032		2	2	1	-	H	
2033		2	2	1	-	H	
2034		2	2	1	-	H	
2035		2	2	1	-	H	

Table 1.186

Compd. No.	R^1 R^2 - $(CH_2)_j-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}$ $(CH_2)_q-G-R^6$
2036	$NC-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})_2-\text{NH}_2$
2037	$H_3C-C_6H_3(\text{CH}_3)_2-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})_2-\text{NH}_2$
2038	$F-C_6H_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})_2-\text{NH}_2$
2039	$H_3C-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_3(\text{CN})_2$
2040	$H_3C-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}(\text{OH})-\text{C}_6H_5-\text{OH}$
2041	$H_3C-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}(\text{OCH}_3)-\text{C}_6H_5$
2042	$H_3C-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{C}_5\text{H}_8$
2043	$H_3C-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-C_6H_3(\text{CH}_3)_2-\text{CH}_3$
2044	$CH_3-\text{O}-\text{C}_5\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6H_5-\text{O}-\text{C}_6H_5$
2045	$CH_3-\text{O}-\text{C}_5\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6H_5-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{C}_6H_5-\text{Cl}$
2046	$CH_3-\text{O}-\text{C}_5\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6H_5-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{C}_6H_5-\text{CH}_3$

Table 1.187

Compd. No.	R^1 R^2	$(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ R^4 R^5	$(CH_2)_q$ G-R ⁶
2047		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H		
2048		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H		
2049		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H		
2050		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H		
2051		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H		
2052		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
2053		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
2054		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
2055		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
2056		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		
2057		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H		

Table 1.188

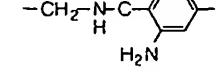
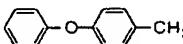
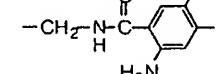
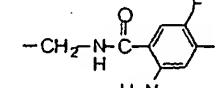
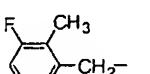
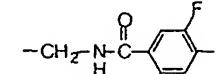
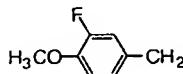
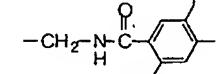
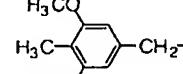
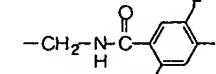
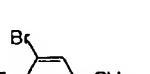
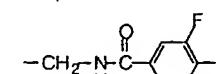
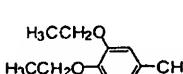
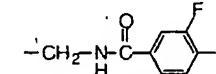
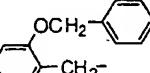
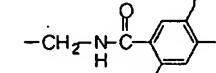
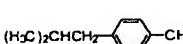
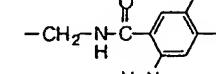
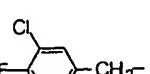
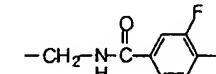
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
2058		2	2	1	-	H	
2059		2	2	1	-	H	
2060		2	2	1	-	H	
2061		2	2	1	-	H	
2062		2	2	1	-	H	
2063		2	2	1	-	H	
2064		2	2	1	-	H	
2065		2	2	1	-	H	
2066		2	2	1	-	H	
2067		2	2	1	-	H	
2068		2	2	1	-	H	

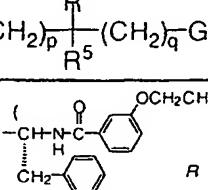
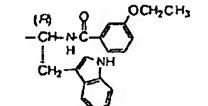
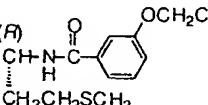
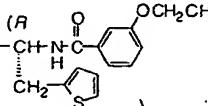
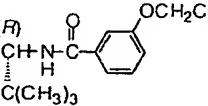
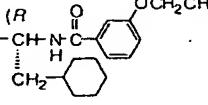
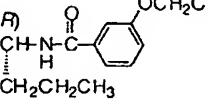
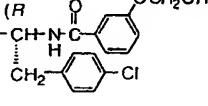
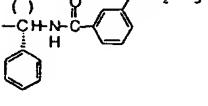
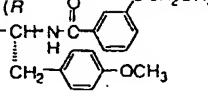
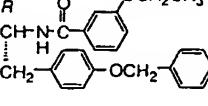
Table 1.189

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_k\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---R}^6$
2069		2	2	1	-	H	
2070		2	2	1	-	H	
2071		2	2	1	-	H	
2072		2	2	1	-	H	
2073		2	2	1	-	H	
2074		2	2	1	-	H	
2075		2	2	1	-	H	
2076		2	2	1	-	H	
2077		2	2	1	-	H	
2078		2	2	1	-	H	
2079		2	2	1	-	H	

Table 1.190

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \text{---} (CH_2)_j \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \text{---} \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} \text{---} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
2080		2	2	1	-	H	
2081		2	2	1	-	H	
2082		2	2	1	-	H	
2083		1	2	0	R	H	
2084		1	2	0	R	H	
2085		1	2	0	R	H	
2086		1	2	0	R	H	
2087		1	2	0	R	H	
2088		1	2	0	R	H	
2089		1	2	0	R	H	
2090		1	2	0	R	H	

Table 1.191

Compd. No.	R^1 R^2 $-(CH_2)_i-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ R^4 R^5 $-(CH_2)_q$ G-R ⁶
2091	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
2092	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
2093	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
2094	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
2095	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
2096	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
2097	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
2098	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
2099	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
2100	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
2101	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	

211

Table 1.192

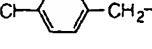
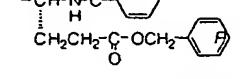
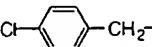
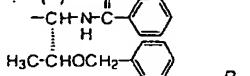
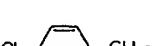
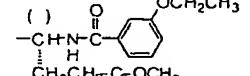
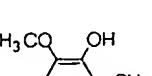
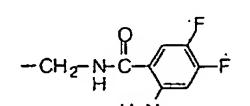
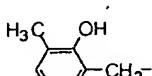
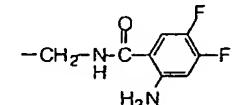
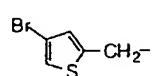
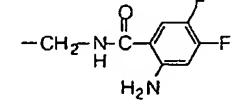
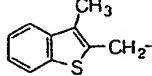
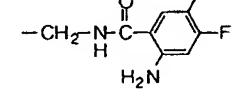
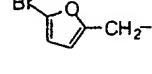
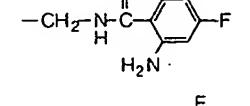
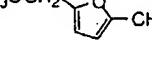
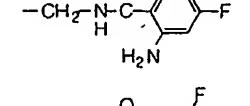
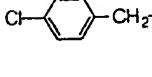
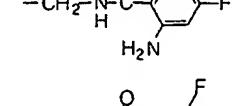
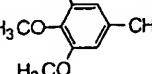
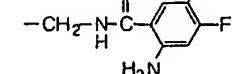
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	R^4 R^5 $\text{---}(\text{CH}_2)_p\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
2102		2	2	1	-	H	
2103		2	2	1	-	H	
2104		2	2	1	-	H	
2105		2	2	1	-	H	
2106		2	2	1	-	H	
2107		2	2	1	-	H	
2108		2	2	1	-	H	
2109		2	2	1	-	H	
2110		2	2	1	-	H	
2111		2	2	1	-	H	
2112		2	2	1	-	H	

Table 1.193

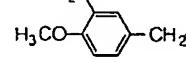
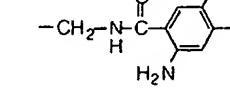
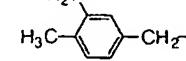
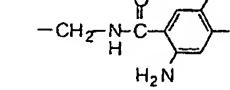
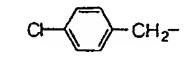
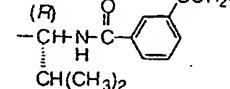
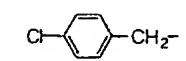
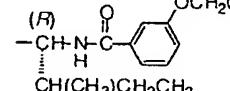
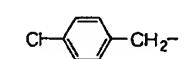
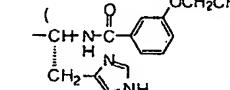
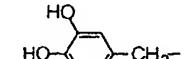
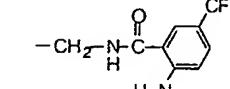
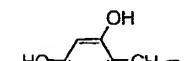
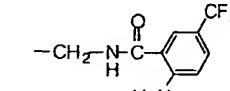
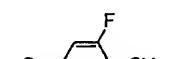
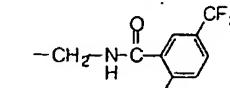
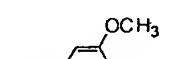
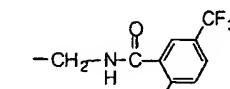
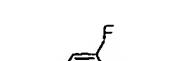
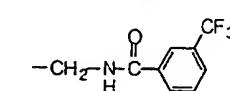
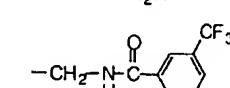
Compd. No.	R^1 R^2 (CH_2) $_j$ —	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\ \\ -C- \\ \\ R^5 \end{array}$ $(CH_2)_q$ —G—R 6
2113		2	2	1	-	H	
2114		2	2	1	-	H	
2115		2	2	1	-	H	
2116		2	2	1	-	H	
2117		2	2	1	-	H	
2118		1	2	0	R	H	
2119		1	2	0	R	H	
2120		1	2	0	R	H	
2121		1	2	0	R	H	
2122		1	2	0	R	H	
2123		1	2	0	R	H	

Table 1.194

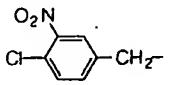
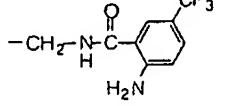
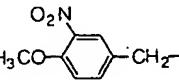
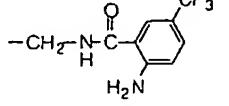
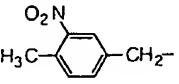
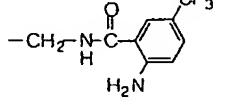
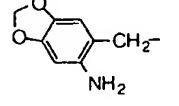
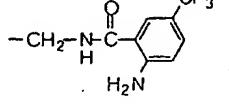
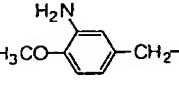
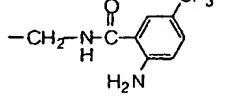
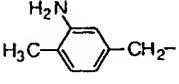
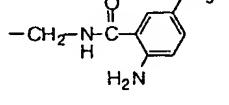
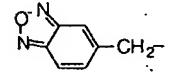
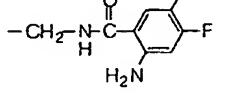
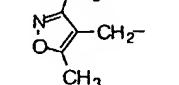
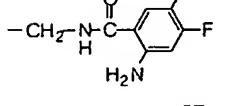
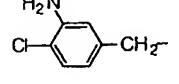
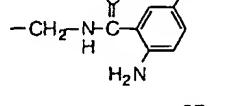
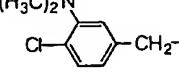
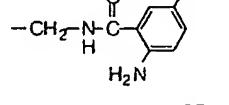
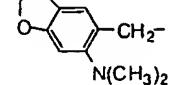
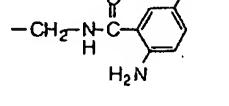
Compd. No.	R^1 R^2 - $(\text{CH}_2)_j$ -	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ - $\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)$ - $(\text{CH}_2)_q$ -G-R 6
2124		1	2	0	R	H	
2125		1	2	0	R	H	
2126		1	2	0	R	H	
2127		1	2	0	R	H	
2128		1	2	0	R	H	
2129		1	2	0	R	H	
2130		2	2	1	-	H	
2131		2	2	1	-	H	
2132		1	2	0	R	H	
2133		1	2	0	R	H	
2134		1	2	0	R	H	

Table 1.195

Compd. No.	R^1 R^2	$(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$	$\begin{array}{c} R^4 \\ \\ -(CH_2)_q \\ \\ R^5 \end{array}$	$G-R^6$
2135			1	2	0	R	H			
2136			1	2	0	R	H			
2137			1	2	0	R	H			
2138			1	2	0	R	H			
2139			1	2	0	R	H			
2140			2	2	1	-	H			
2141			2	2	1	-	H			
2142			2	2	1	-	H			
2143			2	2	1	-	H			
2144			2	2	1	-	H			
2145			2	2	1	-	H			

Table 1.196

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_i\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\begin{array}{c} R^4 \\ \\ \text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---} \end{array}\text{G---}R^6$
2146		2	2	1	-	H	
2147		2	2	1	-	H	
2148		2	2	1	-	H	
2149		1	2	0	R	H	
2150		1	2	0	R	H	
2151		1	2	0	R	H	
2152		1	2	0	R	H	
2153		1	2	0	R	H	
2154		2	2	1	-	H	
2155		2	2	1	-	H	
2156		2	2	1	-	H	

Table 1.197

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2-(CH_2)_j- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
2157		1	2	0	R	H	
2158		1	2	0	R	H	
2159		2	2	1	-	H	
2160		2	2	1	-	H	
2161		2	2	1	-	H	
2162		2	2	1	-	H	
2163		2	2	1	-	H	
2164		1	2	0	R	H	
2165		1	2	0	R	H	
2166		1	2	0	R	H	
2167		1	2	0	R	H	

Table 1.198

Compd. No.	R^1 R^2	$(CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ R^4 R^5 $(CH_2)_q$ G-R ⁶
2168		$(CH_2)_l$	1	2	0	R	H	
2169		$(CH_2)_l$	1	2	0	R	H	
2170		$(CH_2)_l$	1	2	0	R	H	
2171		$(CH_2)_l$	1	2	0	R	H	
2172		$(CH_2)_l$	1	2	0	R	H	
2173		$(CH_2)_l$	1	2	0	R	H	
2174		$(CH_2)_l$	1	2	0	R	H	
2175		$(CH_2)_l$	1	2	0	R	H	
2176		$(CH_2)_l$	1	2	0	R	H	
2177		$(CH_2)_l$	1	2	0	R	H	
2178		$(CH_2)_l$	1	2	0	R	H	

Table 1.199

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}\text{G---}\text{R}^6$
2179		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{---}\text{NH}_2$
2180	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{---}\text{NH}_2$
2181		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{---}\text{NH}_2$
2182		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{---}\text{NH}_2$
2183		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{---}\text{NH}_2$
2184		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_2(\text{F}_2)\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{---}\text{NH}_2$
2185		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_2(\text{F}_2)\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{---}\text{NH}_2$
2186		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_2(\text{F}_2)\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{---}\text{NH}_2$
2187		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_2(\text{F}_2)\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{---}\text{NH}_2$
2188		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_2(\text{F}_2)\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{---}\text{NH}_2$
2189		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}\text{---}\text{C}(=\text{O})\text{---}\text{C}_6\text{H}_2(\text{F}_2)\text{---}\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{---}\text{NH}_2$

Table 1.200

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
2190		2	2	1	-	H	
2191		2	2	1	-	H	
2192		2	2	1	-	H	
2193		2	2	1	-	H	
2194		2	2	1	-	H	
2195		2	2	1	-	H	
2196		1	2	0	R	H	
2197		1	2	0	R	H	
2198		1	2	0	R	H	
2199		2	2	1	-	H	
2200		2	2	1	-	H	

Table 1.201

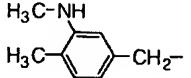
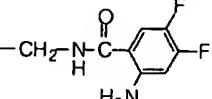
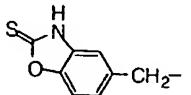
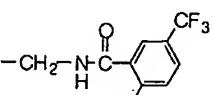
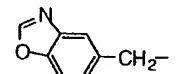
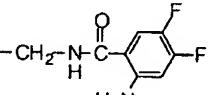
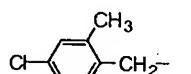
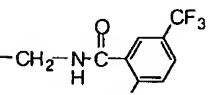
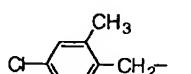
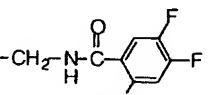
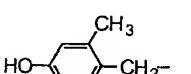
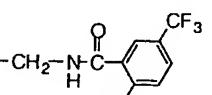
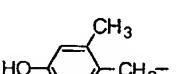
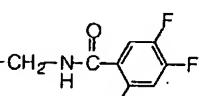
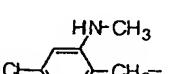
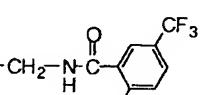
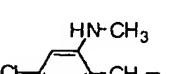
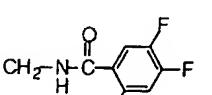
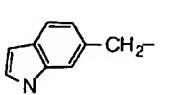
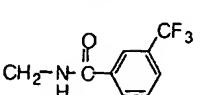
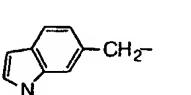
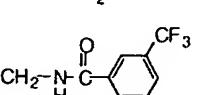
Compd. No.	R^1 R^2 — $(CH_2)_j$ —	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ R^4 R^5 — $(CH_2)_q$ —G— R^6
2201		2	2	1	-	H	
2202		1	2	0	R	H	
2203		2	2	1	-	H	
2204		2	2	1	-	H	
2205		2	2	1	-	H	
2206		2	2	1	-	H	
2207		2	2	1	-	H	
2208		2	2	1	-	H	
2209		2	2	1	-	H	
2210		1	2	0	R	H	
2211		2	2	1	-	H	

Table 1.202

Compd. No.	R^1 R^2 - $(CH_2)_l$ -	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ - $\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}$ - $(CH_2)_q$ -G-R ⁶
2212		2	2	1	-	H	
2213		2	2	1	-	H	
2214		2	2	1	-	H	
2215		1	2	0	R	H	
2216		1	2	0	R	H	
2217		1	2	0	R	H	
2218		1	2	0	R	H	
2219		1	2	0	R	H	
2220		1	2	0	R	H	
2221		1	2	0	R	H	
2222		1	2	0	R	H	

Table 1.203

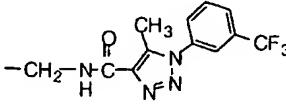
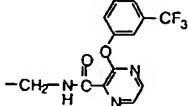
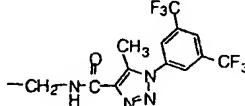
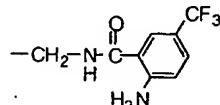
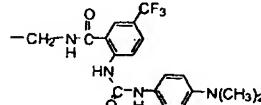
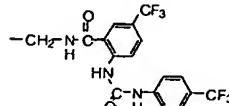
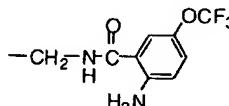
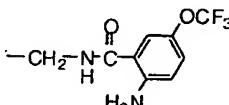
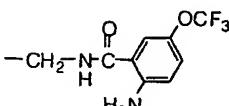
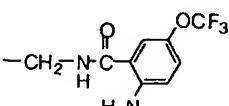
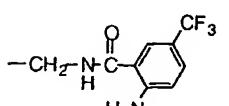
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\begin{array}{c} R^4 \\ \\ \text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6 \\ \\ R^5 \end{array}$
2223	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2224	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2225	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2226	<chem>CC1=C(Cl)N=C(C=C1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2227	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2228	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2229	<chem>CC1=CC=C1OC2=CC=CC=C2</chem>	1	2	0	R	H	
2230	<chem>CC(C)C1=CC=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	
2231	<chem>CC(C)C1=CC=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	
2232	<chem>CC(C)C1=CC=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	
2233	<chem>C1=CC=CC=C1</chem>	1	2	0	R	H	

Table 1.204

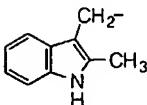
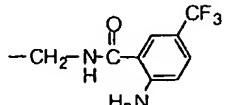
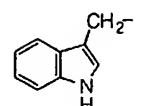
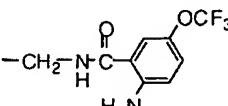
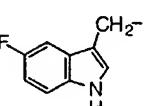
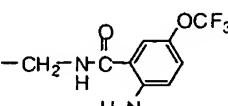
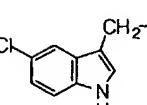
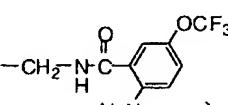
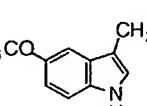
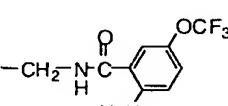
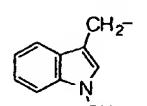
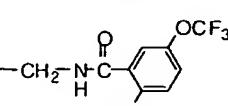
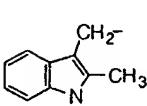
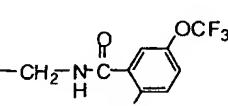
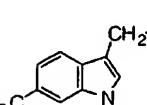
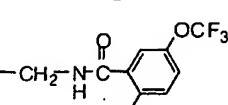
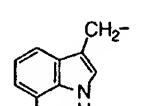
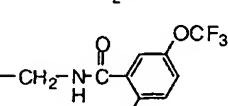
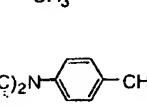
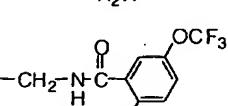
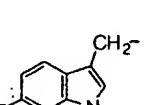
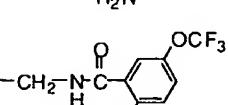
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
2234		1	2	0	R	H	
2235		1	2	0	R	H	
2236		1	2	0	R	H	
2237		1	2	0	R	H	
2238		1	2	0	R	H	
2239		1	2	0	R	H	
2240		1	2	0	R	H	
2241		1	2	0	R	H	
2242		1	2	0	R	H	
2243		1	2	0	R	H	
2244		1	2	0	R	H	

Table 1.205

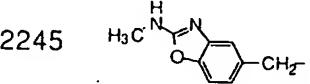
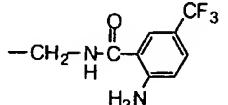
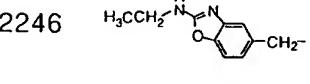
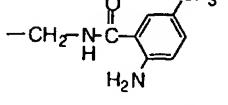
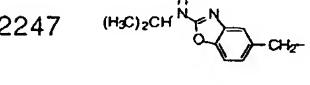
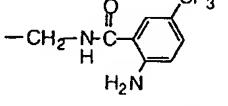
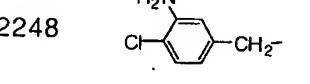
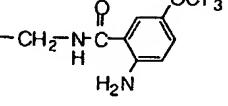
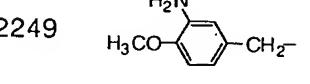
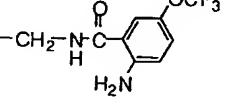
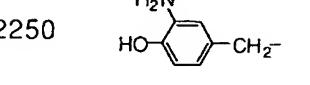
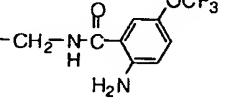
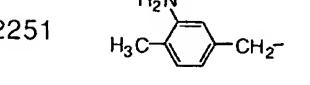
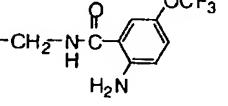
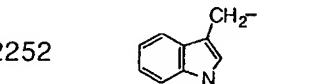
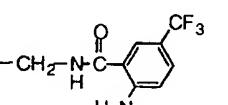
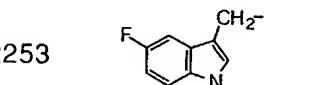
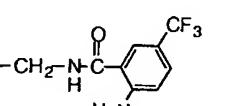
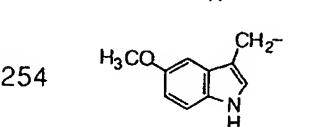
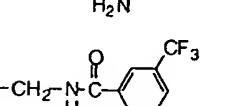
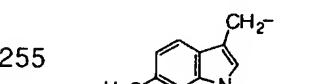
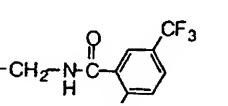
Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH_2-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$\begin{array}{c} R^4 \\ \\ -(CH_2)_p-C(CH_2)_q-G-R^6 \\ \\ R^5 \end{array}$
2245		1	2	0	R	H	
2246		1	2	0	R	H	
2247		1	2	0	R	H	
2248		1	2	0	R	H	
2249		1	2	0	R	H	
2250		1	2	0	R	H	
2251		1	2	0	R	H	
2252		2	2	1	-	H	
2253		2	2	1	-	H	
2254		2	2	1	-	H	
2255		2	2	1	-	H	

Table 1.206

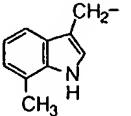
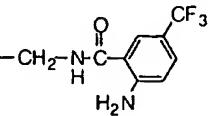
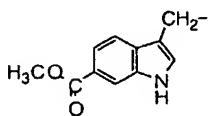
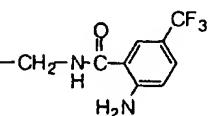
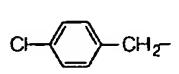
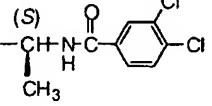
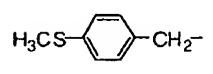
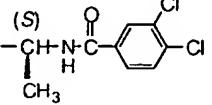
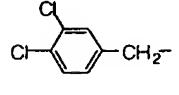
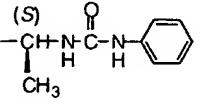
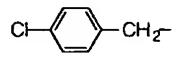
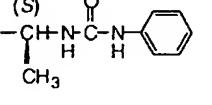
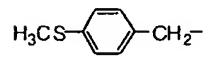
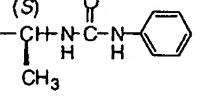
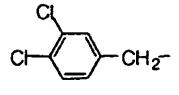
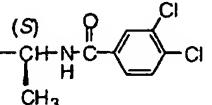
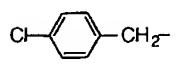
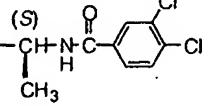
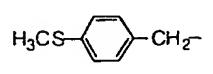
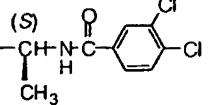
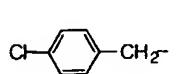
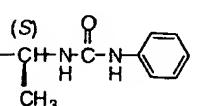
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p \overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{---}}} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
2256		2	2	1	-	H	
2257		2	2	1	-	H	
2258		1	2	0	R	H	
2259		1	2	0	R	H	
2260		1	2	0	R	H	
2261		1	2	0	R	H	
2262		1	2	0	R	H	
2263		1	2	0	S	H	
2264		1	2	0	S	H	
2265		1	2	0	S	H	
2266		1	2	0	S	H	

Table 1.207

Compd. No.	R^1 R^2 — $(CH_2)_j$ —	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ — $\begin{array}{c} R^4 \\ \\ -C- \\ \\ R^5 \end{array}$ — $(CH_2)_q$ —G—R ⁶
2267		2	2	1	-	H	
2268		2	2	1	-	H	
2269		2	2	1	-	H	
2270		2	2	1	-	H	
2271		2	2	1	-	H	
2272		2	2	1	-	H	
2273		2	2	1	-	H	
2274		2	2	1	-	H	
2275		2	2	1	-	H	
2276		2	2	1	-	H	
2277		2	2	1	-	H	

Table 1.208

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{C}(\text{CH}_2)_j$ -	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{C}(\text{R}^4)$ R^5 $-(\text{CH}_2)_q$ G - R^6
2278		1	2	0	R	H	
2279		1	2	0	R	H	
2280		1	2	0	S	H	
2281		1	2	0	S	H	
2282		2	2	1	-	H	
2283		2	2	1	-	H	
2284		2	2	1	-	H	
2285		2	2	1	-	H	
2286		2	2	1	-	H	
2287		2	2	1	-	H	
2288		2	2	1	-	H	

Table 1.209

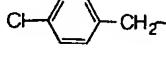
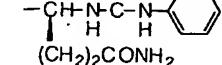
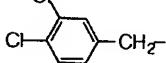
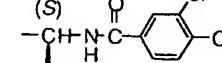
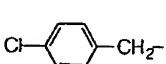
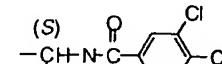
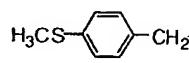
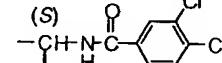
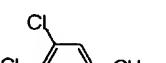
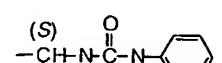
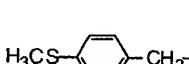
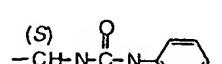
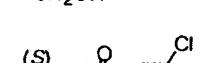
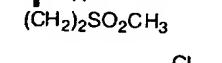
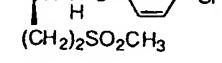
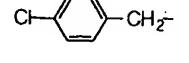
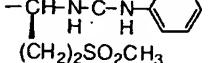
Compd. No.	R^1 R^2 - $\text{C}(\text{CH}_2)_p-$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
2289		2	2	1	-	H	
2290		2	2	1	-	H	
2291		2	2	1	-	H	
2292		2	2	1	-	H	
2293		2	2	1	-	H	
2294		2	2	1	-	H	
2295		2	2	1	-	H	
2296		1	2	0	R	H	
2297		1	2	0	R	H	
2298		1	2	0	R	H	
2299		1	2	0	R	H	

Table 1.210

Compd. No.	R^1 R^2 — $(CH_2)_j$ —	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} \\ (S) \end{array}$ $-\text{CH}-\text{N}-\text{C}-$ $\begin{array}{c} \\ \text{H} \end{array}$ $(CH_2)_2\text{SO}_2\text{CH}_3$	R^4 R^5 $(CH_2)_q$ —G— R^6
2300		1	2	0	S	H		
2301		1	2	0	S	H		
2302		1	2	0	R	H		
2303		1	2	0	R	H		
2304		1	2	0	R	H		
2305		1	2	0	S	H		
2306		1	2	0	S	H		
2307		1	2	0	R	H		
2308		1	2	0	R	H		
2309		1	2	0	S	H		
2310		1	2	0	S	H		

Table 1.211

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\begin{array}{c} R^4 \\ \\ \text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6 \\ \\ R^5 \end{array}$
2311	$\text{H}_3\text{CS}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	1	2	0	S	H	
2312	$\text{H}_3\text{CS}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
2313		1	2	0	R	H	
2314	$\text{H}_3\text{CS}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	1	2	0	S	H	
2315	$\text{Cl}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2316	$\text{Cl}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	1	2	0	S	H	
2317		2	2	1	-	H	
2318		1	2	0	R	H	
2319		2	2	1	-	H	
2320	$\text{Cl}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2321	$\text{H}_3\text{CS}\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	

Table 1.212

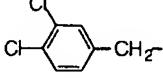
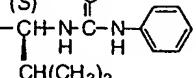
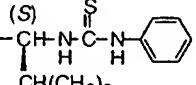
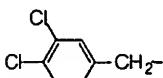
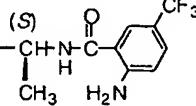
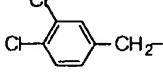
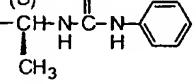
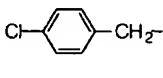
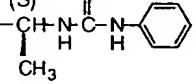
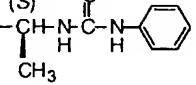
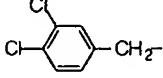
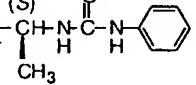
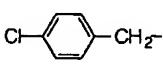
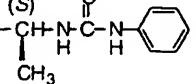
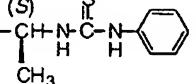
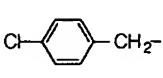
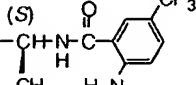
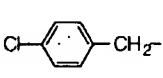
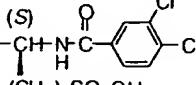
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{--}(\text{CH}_2)_j\text{--}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{--}(\text{CH}_2)_q\text{--}G\text{--}R^6$
2322		2	2	1	-	H	
2323	$\text{H}_3\text{CS}\text{--}\text{C}_6\text{H}_4\text{--}\text{CH}_2\text{--}$	2	2	1	-	H	
2324		2	2	1	-	H	
2325		1	2	0	R	H	
2326		1	2	0	R	H	
2327	$\text{H}_3\text{CS}\text{--}\text{C}_6\text{H}_4\text{--}\text{CH}_2\text{--}$	1	2	0	R	H	
2328		1	2	0	S	H	
2329		1	2	0	S	H	
2330	$\text{H}_3\text{CS}\text{--}\text{C}_6\text{H}_4\text{--}\text{CH}_2\text{--}$	1	2	0	S	H	
2331		1	2	0	S	H	
2332		1	2	0	R	H	

Table 1.213

Table 1.214

Table 1.215

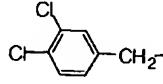
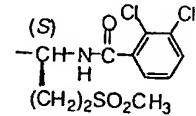
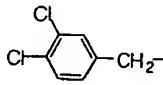
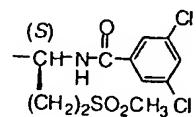
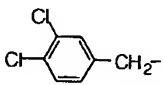
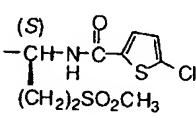
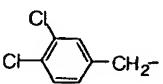
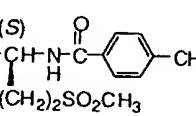
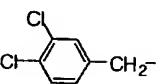
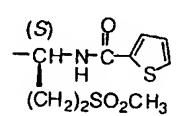
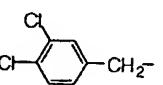
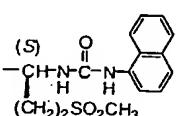
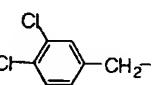
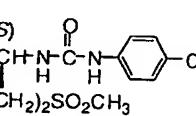
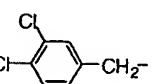
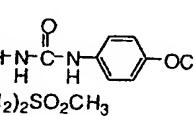
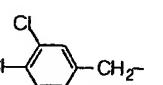
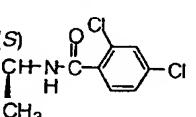
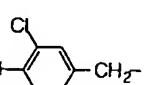
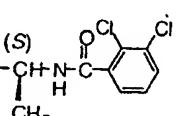
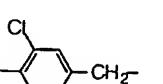
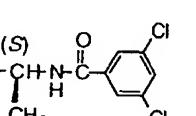
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
2355		1	2	0	R	H	
2356		1	2	0	R	H	
2357		1	2	0	R	H	
2358		1	2	0	R	H	
2359		1	2	0	R	H	
2360		1	2	0	R	H	
2361		1	2	0	R	H	
2362		1	2	0	R	H	
2363		2	2	1	-	H	
2364		2	2	1	-	H	
2365		2	2	1	-	H	

Table 1.216

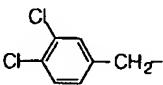
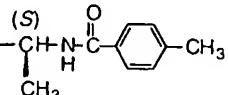
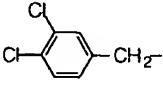
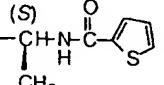
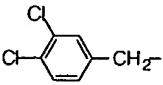
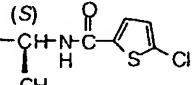
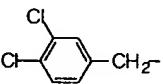
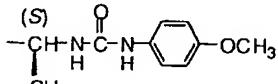
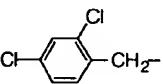
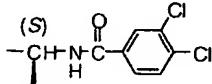
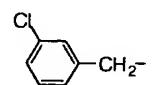
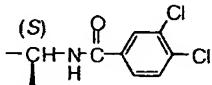
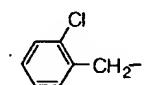
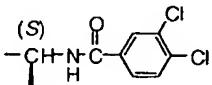
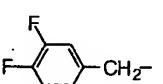
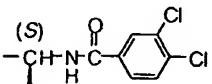
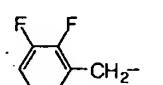
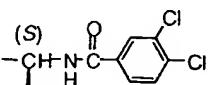
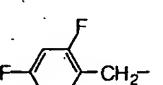
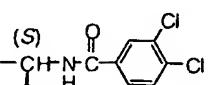
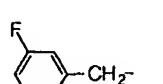
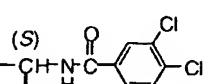
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
2366		2	2	1	-	H	
2367		2	2	1	-	H	
2368		2	2	1	-	H	
2369		2	2	1	-	H	
2370		2	2	1	-	H	
2371		2	2	1	-	H	
2372		2	2	1	-	H	
2373		2	2	1	-	H	
2374		2	2	1	-	H	
2375		2	2	1	-	H	
2376		2	2	1	-	H	

Table 1.217

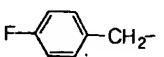
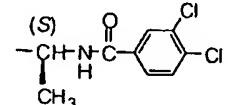
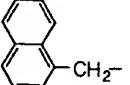
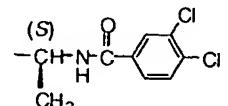
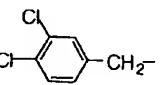
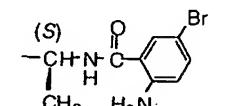
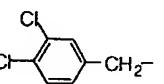
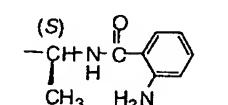
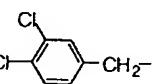
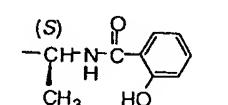
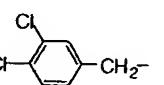
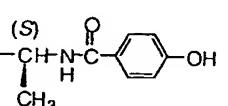
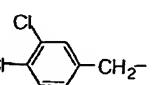
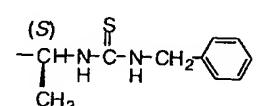
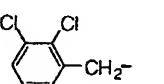
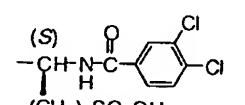
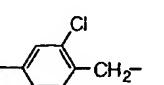
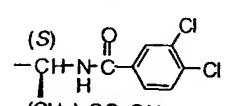
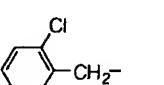
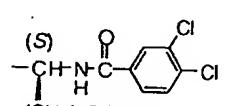
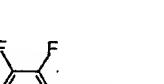
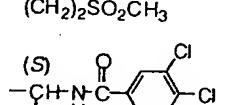
Compd. No.	R^1 R^2 - $(CH_2)_j$ -	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ - $\overset{R^4}{\underset{R^5}{C}}-(CH_2)_q$ -G-R ⁶
2377		2	2	1	-	H	
2378		2	2	1	-	H	
2379		2	2	1	-	H	
2380		2	2	1	-	H	
2381		2	2	1	-	H	
2382		2	2	1	-	H	
2383		2	2	1	-	H	
2384		1	2	0	R	H	
2385		1	2	0	R	H	
2386		1	2	0	R	H	
2387		1	2	0	R	H	

Table 1.218

Compd. No.	R^1 R^2	$\text{---}(\text{CH}_2)_i\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---}(\text{CH}_2)_p\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
2388		$\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
2389		$\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
2390		$\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
2391		$\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
2392		$\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
2393		$\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
2394		$\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2395		$\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2396		$\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2397		$\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
2398		$\text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---}$	2	2	1	-	H	

Table 1.219

Compd. No.	R^1 R^2 — $(CH_2)_j$ —	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p$ — $\begin{array}{c} R^4 \\ \\ -CH-N-C(=O)-C_6H_3-Cl \\ \\ H_2C- \\ \\ H \end{array}$ — $(CH_2)_q$ —G— R^6
2399		2	2	1	-	H	
2400		2	2	1	-	H	
2401		2	2	1	-	H	
2402		2	2	1	-	H	
2403		2	2	1	-	H	
2404		2	2	1	-	H	
2405		2	2	1	-	H	
2406		2	2	1	-	H	
2407		2	2	1	-	H	
2408		2	2	1	-	H	
2409		2	2	1	-	H	

Table 1.220

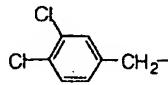
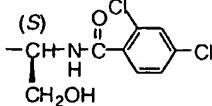
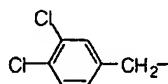
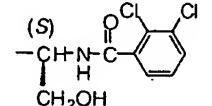
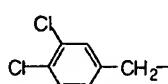
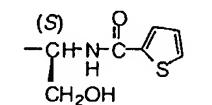
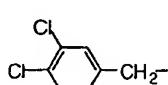
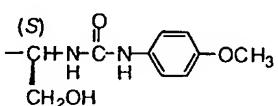
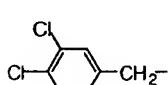
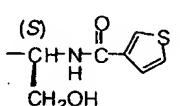
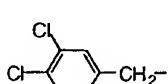
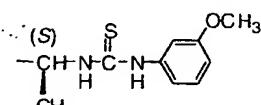
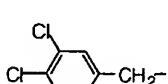
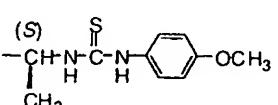
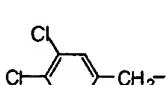
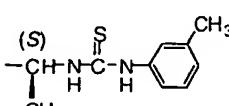
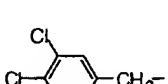
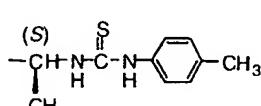
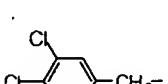
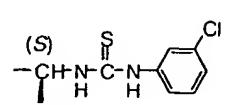
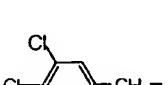
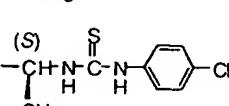
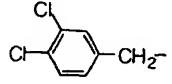
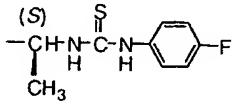
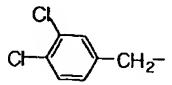
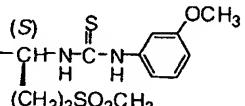
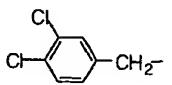
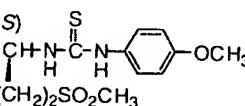
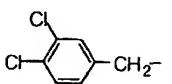
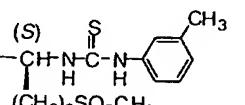
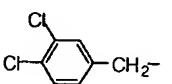
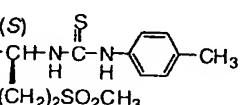
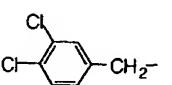
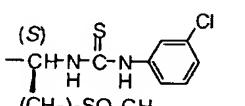
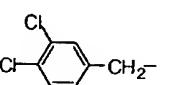
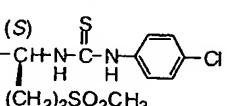
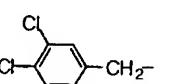
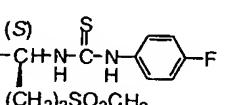
Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---}(\text{CH}_2)_i\text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
2410		2	2	1	-	H	
2411		2	2	1	-	H	
2412		2	2	1	-	H	
2413		2	2	1	-	H	
2414		2	2	1	-	H	
2415		2	2	1	-	H	
2416		2	2	1	-	H	
2417		2	2	1	-	H	
2418		2	2	1	-	H	
2419		2	2	1	-	H	
2420		2	2	1	-	H	

Table 1.221

Compd. No.	R^1 R^2 $\text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{array}{c} R^4 \\ \\ \text{---} \text{C} \text{---} \\ \\ \text{---} \text{N} \text{---} \text{C} \text{---} \text{S} \text{---} \\ \\ \text{---} \text{H} \text{---} \end{array} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G} \text{---} R^6$
2421		2	2	1	-	H	
2422		1	2	0	R	H	
2423		1	2	0	R	H	
2424		1	2	0	R	H	
2425		1	2	0	R	H	
2426		1	2	0	R	H	
2427		1	2	0	R	H	
2428		1	2	0	R	H	

本発明においては、環状アミン化合物の酸付加体も用いられる。かかる酸として、例えば塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、炭酸などの鉱酸；マレイン酸、クエン酸、リンゴ酸、酒石酸、フマル酸、メタンスルホン酸、トリフルオロ酢酸、蟻酸などの有機酸が挙げられる。

5 さらに、本発明においては、例えばヨウ化1-(4-クロロベンジル)-1-メチル-4-[{N-(3-トリフルオロメチルベンゾイル)グリシル}アミノメチル]ピペリジニウムのような、環状アミン化合物のC₁-C₆アルキル付加体も用いられる。ここで、アルキル基としては、例えばメチル、エチル、n-プロピル、n-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、イソプロピル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、2-メチルペンチル、1-エチルブチル基が好適な具体例として挙げられるが、特に好ましい例としては、メチル基、エチル基が挙げられる。また、アンモニウム陽イオンの対陰イオンの好適な具体例としては、フッ化物、塩化物、臭化物、またはヨウ化物などのハロゲン化物陰イオンを挙げることが

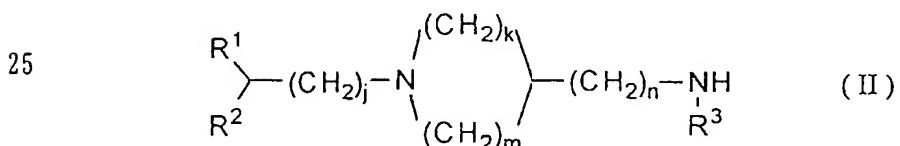
10 できる。

本発明においては、上記式(I)で表される化合物のラセミ体、および可能なすべての光学活性体も用いることができる。

上記式(I)で表される化合物は、国際公開WO 9925686号パンフレットに記載されているように、下記に示すいずれかの一般的な製造法を用いることにより合成可能である。

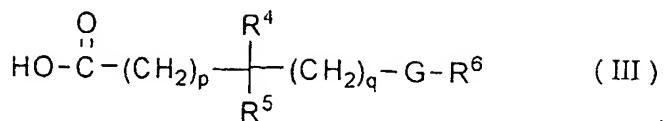
(製造法1)

下記式(II)



〔式中、R¹、R²、R³、j、k、m、およびnは、上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じである。〕
30 で表される化合物1当量と、下記式(III)

5



[式中、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 G 、 p 、および q は、上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じである。]

10 で表されるカルボン酸、またはその反応性誘導体の0.1-1.0当量を無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

上記式(III)で表されるカルボン酸の「反応性誘導体」とは、例えば酸ハロゲン化物、酸無水物、混合酸無水物などの合成有機化学分野において通常使用される反応性の高いカルボン酸誘導体を意味する。

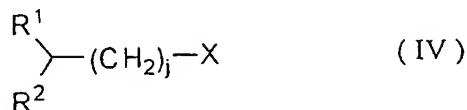
かかる反応は、適当量のモレキュラーシーブなどの脱水剤；ジシクロヘキシリカルボジイミド(DCC)、 N -エチル- N' -(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド(EDCIまたはWSC)、カルボニルジイミダゾール(CDI)、 N -ヒドロキシサクシンイミド(HOSu)、 N -ヒドロキシベンゾトリアゾール(HOBt)、ベンゾトリアゾール-1-イルオキシトリス(ピロリジノール)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート(PyBOP)、2-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-1,1,3,3-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート(HBTU)、2-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-1,1,3,3-テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート(TBTU)、2-(5-ノルボルネン-2,3-ジカルボキシイミド)-1,1,3,3-テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート(TNTU)、 O -(N -サクシニミジル)-1,1,3,3-テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート(TSTU)、プロモトリス(ピロリジノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート(PyBzOP)などの縮合剤；炭酸カリウム、炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウムなどの無機塩基、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジンなどのアミン類、(ビペリジノメチル)ポリスチレン、(モルホリノメチル)ポリスチレン、(ジメチルアミノメチル)ポリスチレン、ポリ(4-ビニルピリジン)などの高分子支持塩基などの塩基を適宜用いることにより、より円滑に進

行させることができる。

(製造法 2)

下記式 (IV)

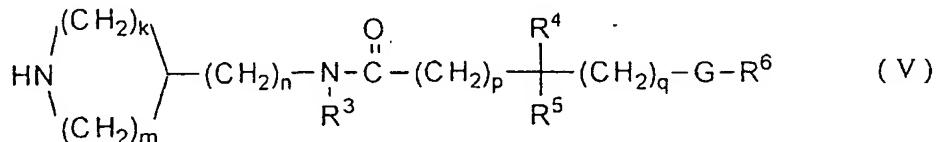
5



10 [式中、 R^1 、 R^2 、および j は、上記式 (I) におけるそれぞれの定義と同じであり、 X はハロゲン原子、アルキルスルホニルオキシ基、またはアリールスルホニルオキシ基を表す。]

で表されるアルキル化試薬 1 当量と、下記式 (V)

15



20 [式中、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 G 、 k 、 m 、 n 、 p 、および q は、上記式 (I) におけるそれぞれの定義と同じである。]

で表される化合物 0.1 – 1.0 当量を無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

かかる反応は、上記製造法 1 と同様の塩基を適宜用いることにより、より円滑に 25 進行させることができる。さらに、本製造方法において、ヨウ化カリウム、ヨウ化ナトリウムなどのヨウ化物を共存させることにより、反応を促進できる場合がある。

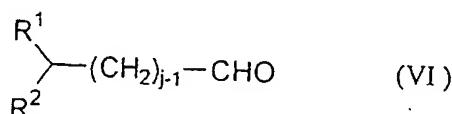
上記式 (IV) において、 X はハロゲン原子、アルキルスルホニルオキシ基、アリールスルホニルオキシ基を表す。かかるハロゲン原子としては、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が好ましく挙げられる。アルキルスルホニルオキシ基の好適な具体 30 例としては、メチルスルホニルオキシ基、トリフルオロメチルスルホニルオキシ基

などが挙げられる。アリールスルホニルオキシ基の好適な具体例としては、トシリオキシ基を挙げることができる。

(製造法3)

下記式(VI)

5



10

[式中、R¹およびR²は、上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じであり、jは1または2を表す。]

または、下記式(VII)

15



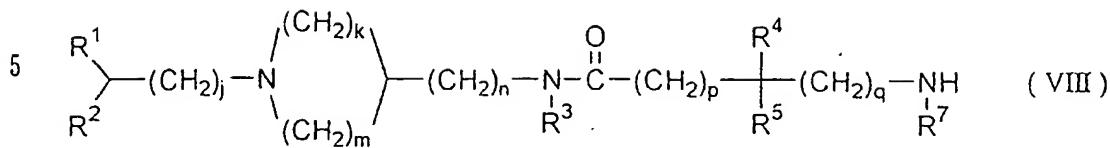
[式中、R¹は、上記式(I)におけるR¹の定義と同じであり、jは0を表す場合に相当する。]

で表されるアルデヒド1当量と、上記式(V)で表される化合物0.1-1.0当量20を、無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

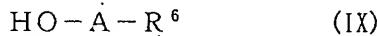
かかる反応は、一般に還元的アミノ化反応と呼ばれ、還元条件としては、パラジウム、白金、ニッケル、ロジウムなど金属を含む触媒を用いる接触水素添加反応、水素化リチウムアルミニウム、水素化ホウ素ナトリウム、シアノ水素化ホウ素ナトリウム、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウムなどの複合水素化物およびボラン25を用いる水素化反応、または電解還元反応などを用いることができる。

(製造法4)

下記式(VIII)



10 [式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 j 、 k 、 m 、 n 、 p 、および q は、上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じである。]
で表される化合物1当量と、下記式(IX)



15 [式中、 R^6 は、上記式(I)における R^6 の定義と同じであり、 A はカルボニル基またはスルホニル基を表す。]

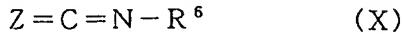
20 で表されるカルボン酸またはスルホン酸、またはそれらの反応性誘導体0.1-10当量を、無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

上記式(IX)で表されるカルボン酸またはスルホン酸の反応性誘導体とは、例えば酸ハロゲン化物、酸無水物、混合酸無水物などの、合成有機化学分野で一般に使用される反応性の高いカルボン酸またはスルホン酸誘導体を意味する。

かかる反応は、上記製造法1と同様の脱水剤、縮合剤、または塩基を適宜用いることにより、より円滑に進行させることができる。

(製造法5)

25 上記式(VIII)で表される化合物1当量と、下記式(X)



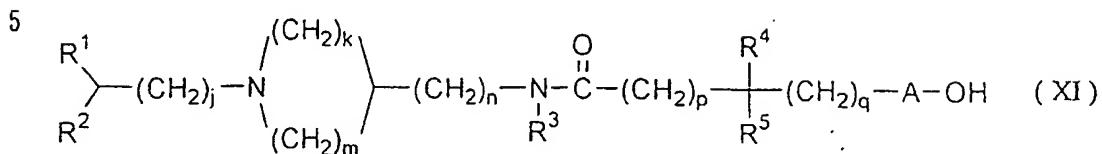
30 [式中、 R^6 は上記式(I)における R^6 の定義と同じであり、 Z は酸素原子または硫黄原子を表す。]

で表されるイソシアネートまたはイソチオシアネート0.1-10当量を、無溶媒

下または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

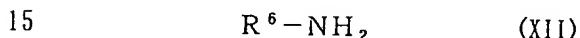
(製造法 6)

下記式 (XI)



10 [式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 j 、 k 、 m 、 n 、 p 、 および q は、 上記式 (I) におけるそれぞれの定義と同じであり、 A はカルボニル基またはスルホニル基を表す。]

で表される化合物 1 当量と、 下記式 (XII)



[式中、 R^6 は、 上記式 (I) における R^6 の定義と同じである。]

で表されるアミン 0.1 – 1.0 当量を、 無溶媒下または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

20 かかる反応は、 上記製造法 1 と同様の脱水剤、 縮合剤、 または塩基を適宜用いることにより、 より円滑に進行させることができる。

上記製造法 1 – 6 において、 各反応に供する基質が、 一般に有機合成化学において各反応条件において反応するか、 あるいは反応に悪影響を及ぼすことが考えられる置換基を有する場合には、 その官能基を既知の適当な保護基で保護して反応に供25 した後、 従来既知の方法を用いて脱保護することにより、 目的の化合物を得ることができる。

さらに、 本発明で用いられる化合物は、 例えばアルキル化反応、 アシリ化反応、 還元反応などの、 一般に有機合成化学において使用される既知の反応を用いて、 上記製造法 6 により製造される化合物の（単数または複数の）置換基をさらに変換することによっても得ることができる。

30 上記各製造法において、 反応溶媒としてはジクロロメタン、 クロロホルムなどの

ハロゲン化炭化水素、ベンゼン、トルエンなどの芳香族炭化水素、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類、酢酸エチルなどのエ斯特ル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アセトニトリルなどの非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどのアルコール類など

5 が反応に応じて適宜用いられる。

いずれの製造方法においても、反応温度は-78°Cから+150°C、好ましくは0°Cから100°Cの範囲である。反応完了後、通常の単離、精製操作、すなわち濃縮、濾過、抽出、固相抽出、再結晶、クロマトグラフィーなどを行うことにより、目的とする上記式(I)で表される環状アミン化合物を単離することができる。また、それらは通常の方法により、薬学的に許容される酸付加体またはC₁-C₆アルキル付加体に変換することができる。

実施例

本発明を以下、実施例に基づいて説明する。しかしながら、本発明はこれらの実施例に限定されるものではない。以下の実施例において各化合物に付された化合物番号は、Table 1, 1-1, 221において好適な具体例として挙げた化合物に付された化合物番号(Compound No.)と対応している。

[参考例1] (R)-1-(4-クロロベンジル)-3-[{N-(3,4-ジフルオロベンゾイル)グリシル}アミノ]ピロリジン(化合物番号69)の合成

本発明の化合物はWO 99 25686号パンフレット記載の製造法により合成したが、例えば化合物番号69の(R)-1-(4-クロロベンジル)-3-[{N-(3,4-ジフルオロベンゾイル)グリシル}アミノ]ピロリジンは以下のように合成した。

25

1) 3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン・二塩酸塩

4-クロロベンジルクロリド(4.15g, 25, 8mmol)と*i*-Pr₂NEt(6.67g, 51.6mmol)を、3-[*tert*-ブトキシカルボニル]アミノ]ピロリジン(4.81g, 25.8mmol)のDMF溶液(50mL)に加えた。反応混合物を70°Cで15時間攪拌し、溶媒を減圧下に除去した。再結晶(CH₃CN, 50mL)により目的とする3-[*tert*-ブトキシカルボ

ニル) アミノ} -1- (4-クロロベンジル) ピロリジン (6. 43 g, 80%) を黄白色固体として得た:

¹H-NMR (CDCl₃, 300 MHz) δ

1.37 (s, 9 H), 1.5-1.7 (br, 1 H), 2.1-2.4 (m, 2 H), 2.5-2.7 (m, 2 H), 2.83 (br, 1 H), 3.57 (s, 2 H), 4.1-4.3 (br, 1 H), 4.9-5.1 (br, 1 H), 7.15-7.35 (br, 4 H); 純度はRPLC/MSで求めた (98%); ESI/MS m/e 311.0 (M⁺+H, C₁₆H₂₄C₁N₂O₂)

3- { (tert-ブトキシカルボニル) アミノ} -1- (4-クロロベンジル) ピロリジン (6. 38 g, 20. 5 mmol) のCH₃OH (80 mL) 溶液に 1 M HCl-Et₂O (100 mL) を加え、25°Cで15時間攪拌した。溶媒を減圧下に除去し、固体を得、再結晶 (CH₃OH/CH₃CN=1:2, 130 mL) で精製することにより、3-アミノ-1- (4-クロロベンジル) ピロリジン・二塩酸塩 (4. 939 g, 85%) を白色粉末として得た:

¹H-NMR (d₆-DMSO, 300 MHz) δ

15 3.15 (br, 1 H), 3.3-3.75 (br-m, 4 H), 3.9 (br, 1 H), 4.05 (br, 1 H), 4.44 (br, 1 H), 4.54 (br, 1 H), 7.5-7.7 (m, 4 H), 8.45 (br, 1 H), 8.60 (br, 1 H); 純度はRPLC/MSで求めた (>99%); ESI/MS m/e 211.0 (M⁺+H, C₁₁H₁₆C₁N₂)

光学活性 (R) -3-アミノ-1- (4-クロロベンジル) ピロリジン・二塩酸塩と (S) -3-アミノ-1- (4-クロロベンジル) ピロリジン・二塩酸塩を、それぞれ対応する原料を用いて上記の方法により合成した。生成物は、上記ラセミ体と同じ¹H-NMRを示した。

2) (R) -3- { (N-tert-ブトキシカルボニル) グリシル} アミノ-1- (4-クロロベンジル) ピロリジン

(R) -3-アミノ-1- (4-クロロベンジル) ピロリジン・二塩酸塩 (4. 54 g, 16. 0 mmol)、2M NaOH溶液 (80 mL)、および酢酸エチル (80 mL) の混合物を攪拌し、有機層を分離し、水層を酢酸エチル (80 mL × 2) で抽出した。有機層を合わせて無水硫酸ナトリウムで乾燥、濾過、濃縮することにより遊離の (R) -3-アミノ-1- (4-クロロベンジル) ピロリジン (3. 35 g, 99%)を得た。

(R) - 3 - アミノ - 1 - (4 - クロロベンジル) ピロリジン (3. 35 g, 1 6 mmol) の CH_2Cl_2 (80 mL) 溶液に、 Et_3N (2. 5 mL, 17. 6 mol) 、 N - *tert* - プトキシカルボニルグリシン (2. 79 g, 16. 0 mol) 、 EDC I (3. 07 g, 16. 0 mmol) および HOBT (12. 1 6 g, 16 mmol) を加えた。反応混合物を 25°C で 16 時間攪拌した後、 2 M NaOH 溶液 (80 mL) を加えた。有機層を分離し、水層をジクロロメタンで抽出した (100 mL × 3)。有機層を合わせて水 (100 mL × 2) と食塩水 (100 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、濾過、濃縮した。カラムクロマトグラフィー (SiO_2 、酢酸エチル) により、目的とする (R) - 3 - { N - (*tert* - プトキシカルボニル) グリシリル} アミノ - 1 - (4 - クロロベンジル) ピロリジン (5. 40 g, 92%) を得た。

3) (R) - 1 - (4 - クロロベンジル) - 3 - (グリシリルアミノ) ピロリジンの合成

(R) - 3 - { N - (*tert* - プトキシカルボニル) グリシリル} アミノ - 1 - (4 - クロロベンジル) ピロリジン (5. 39 g, 14. 7 mmol) のメタノール (60 mL) 溶液に、 4 M HCl ジオキサン (38 mL) 溶液を加えた。この溶液を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、 2 M NaOH 溶液 (8.0 mL) を加えた。混合液をジクロロメタン (80 mL × 3) で抽出し、抽出液を合わせて無水硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮した。カラムクロマトグラフィー (SiO_2 、 $\text{AcOEt}/\text{EtOH}/\text{Et}_3\text{N} = 90/5/5$) により、 (R) - 3 - (グリシリルアミノ) - 1 - (4 - クロロベンジル) ピロリジン (3. 374 g, 86%) を得た: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 、 270 MHz) δ 1.77 (dd, $J = 1.3$ および 6.9 Hz, 1 H), 2.20-3.39 (m, 2 H), 2.53 (dd, $J = 3.3$ および 9.6 Hz, 1 H), 2.62 (dd, $J = 6.6$ および 9.6 Hz, 1 H), 2.78-2.87 (m, 1 H), 3.31 (s, 2 H), 3.57 (s, 2 H), 4.38-4.53 (br, 1 H), 7.18-7.32 (m, 4 H), 7.39 (br, s, 1 H)

4) (R) - 1 - (4 - クロロベンジル) - 3 - [{ N - (3, 4 - ジフルオロベニゾイル) グリシリル} アミノ] ピロリジン (化合物番号 69)
 3, 4 - ジフルオロベンゾイルクロリド (0. 060 mmol) のクロロホルム

溶液 (0. 4 mL) を、 (R) - 1 - (4-クロロベンジル) - 3 - (グリシルアミノ) ピロリジン (0. 050 mmol) とトリエチルアミン (0. 070 mmol) のクロロホルム (1. 0 mL) 溶液に加えた。この反応混合物を室温で 2. 5 時間攪拌した後、 (アミノメチル) ポリスチレン樹脂 (1. 04 mmol/g, 5 5 mg, 50 mmol) を加え、混合物を室温で 12 時間攪拌した。反応混合物を濾過し、樹脂をジクロロメタン (0. 5 mL) で洗浄した。濾液と洗液とを合わせ、ジクロロメタン (4 mL) を加え、溶液を 2 M NaOH 水溶液 (0. 5 mL) にて洗浄し、濃縮することにより、 (R) - 1 - (4-クロロベンジル) - 3 - [{N- (3, 4-ジフルオロベンゾイル) グリシル} アミノ] ピロリジン (化合物番号 69) を得た (7. 8 mg, 38%) : 純度は RPLC/MS で求めた (> 9 9%) ; ESI/MS m/e 408. 0 (M⁺+H, C₂₀H₂₀C₁F₂N₃O₂)

[実施例 1] エオタキシンにより惹起される CCR 3 発現細胞の細胞内カルシウム濃度上昇に対する被験化合物の阻害能の測定

15 CCR 3 レセプターを安定して発現する K562 細胞を用いて、細胞内カルシウム濃度上昇に対する本発明による化合物の阻害能を次の方法にて測定した。

CCR 3 発現 K562 細胞を 10 mM HEPES 含有 HBSS 溶液に懸濁したものに 1 mM Fura 2 アセトキシメチルエステル (同仁化学社製) を加え、 3 7 °C にて 30 分間インキュベートした。これを 340 nm と 380 nm で励起し、 20 340 / 380 比をモニターすることにより、細胞内カルシウム濃度を測定した。アゴニストとしてヒトエオタキシン (0. 5 μg/ml) を用い、被験化合物の阻害能はエオタキシンで刺激する 5 分前に CCR 3 発現 K562 細胞を被験化合物で処理したときの細胞内カルシウム濃度を測定し、下記の式により抑制率 (%) を算出した。

25

$$\text{抑制率 (\%)} = \{1 - (A - B) / (C - B)\} \times 100$$

(A : 被験化合物で処理した後エオタキシンで刺激したときの細胞内カルシウム濃度、 B : 無刺激のときの細胞内カルシウム濃度、 C : 被験化合物で処理せずにエオタキシンで刺激したときの細胞内カルシウム濃度)

30 本発明で用いる環状アミン誘導体の阻害能を測定したところ、例えば、下記の化

合物は、10 μMの濃度において、それぞれ20-50%、50%-80%、および、>80%の阻害能を示した。

10 μMの濃度において20%-50%の阻害能を示した化合物：

化合物番号 11、156、234、330、392、424、481、523、5
5 25、533、558、567、582、602、613、630、646、64
9、701、738、741、754、767、814、816、833、839
、873、902、909、945、1002、1159、1170、1258、
1315、1352、1357、1407、1417、1448、1472、15
04、1508、1531、1558、1562、1569、1661、1670
10 、1686、1719、1751、1756、1769、1775、1783、1
797、1802、1803、1815、1834、1841、1846、188
3、1887、1889、1892、1913、1924、1928、1960、
2006、2013、2035、2052、2083、2113、2127、21
36、2189、2320、2321、2323、2327、2330、2334
15 、2336、2338、2345、2394、2394、2398、2398、2
400、2400、2406、2406、2407、2407、2409、240
9、2420、2420、2421、2421

10 μMの濃度において50%-80%の阻害能を示した化合物：

化合物番号 83、115、146、150、216、294、297、322、4
20 05、440、459、461、466、482、484、487、490、49
2、503、526、528、550、562、570、578、620、623
、659、685、687、703、716、730、733、755、770、
850、856、867、876、998、1015、1024、1223、12
59、1267、1295、1377、1402、1412、1420、1485
25 、1519、1550、1560、1595、1601、1650、1701、1
725、1754、1836、1856、1870、1912、1923、192
9、2095、2120、2138、2179、2258、2260、2261、
2267、2268、2270、2275、2276、2278、2287、22
90、2291、2294、2297、2300、2301、2302、2307
30 、2309、2313、2317、2322、2324、2326、2328、2
329、2333、2335、2343、2344、2346、2347、234

329、2333、2335、2343、2344、2346、2347、2348、2350、2351、2353、2358、2360、2361、2364、2365、2368、2369、2377、2379、2381、2402、2403、2404、2405、2408、2410、2411、2416、2417
5 、2418

10 μ Mの濃度において>80%の阻害能を示した化合物：

化合物番号7、32、68、169、173、203、209、215、520、544、547、851、852、855、874、910、1003、1012、1032、1038、1042、1043、1046、1114、1190、10
10 244、1247、1384、1441、1513、1527、1545、1582、1673、1687、1689、1705、1850、1869、1871、1876、1877、1899、2027、2289、2293、2296、2298、2315、2318、2319、2325、2332、2349、2352、2354、2355、2356、2357、2359、2362、2363、2
15 366、2367、2370、2371、2372、2373、2374、2375、2376、2378、2382、2383、2390、2393、2396、2412、2413、2414、2415、2422、2423、2424、2425、2426、2427、2428

20 [実施例2] CCR3発現細胞膜画分へのエオタキシンの結合に対する阻害能の測定

ヒトCCR3発現K562細胞より調製した細胞膜画分を0.5mg/mLになるようにアッセイバッファー(25mM HEPES, pH7.6, 1mM CaCl₂, 5mM MgCl₂, 0.5%BSA)に懸濁し膜画分懸濁液とした。被験化合物をアッセイバッファーで希釈した溶液を被験化合物溶液とした。[¹²⁵I]標識ヒトエオタキシン(アマシャム社製)を1 μ Ci/mLになるようにアッセイバッファーで希釈した溶液を標識リガンド溶液とした。0.5%BSAで被覆した96ウェルマイクロプレートに、1ウェルあたり被験化合物溶液25 μ L、標識リガンド溶液25 μ L、膜画分懸濁液50 μ Lの順番に分注し攪拌後(反応溶液100 μ L)、25°Cで90分インキュベートした。

30 反応終了後、あらかじめ0.5%ポリエチレンイミン溶液にフィルターを浸漬した96ウェルフィルタープレート(ミリポア社製)で反応液をフィルター滿過し、フィ

ルターを冷洗浄バッファー（アセイバッファー+0.5M NaCl）150μLで4回洗浄した（冷洗浄バッファー150μLを加えた後、濾過）。フィルターを風乾後、液体シンチレーターを1ウェルあたり25μLずつ加え、フィルター上の膜画分が保持する放射能をトップカウント（パッカード社製）にて測定した。

5 被験化合物の代わりに非標識ヒトエオタキシン100ngを添加したときのカウントを非特異的吸着として差し引き、被験化合物を何も添加しないときのカウントを100%として、ヒトエオタキシンのCCR3膜画分への結合に対する被験化合物の阻害能を算出した。

10 阻害率(%) = {1 - (A - B) / (C - B)} × 100

(A: 被験化合物添加時のカウント、B: 非標識ヒトエオタキシン100ng添加時のカウント、C: [¹²⁵I]標識ヒトエオタキシンのみ添加したときのカウント)

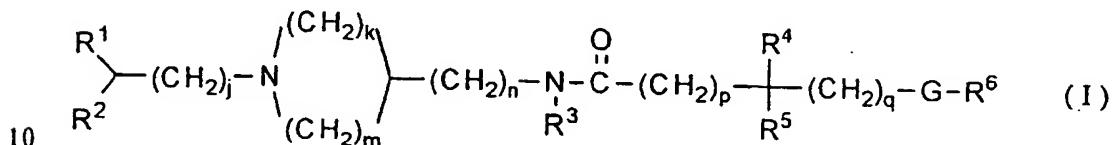
本発明で用いる環状アミン誘導体の阻害能を測定したところ、本実施例における
15 代表的な化合物の阻害能は、実施例1で認められた阻害能とほぼ同等であった。

産業上の利用可能性

本発明の環状アミン化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容されるC₁—C₆アルキル付加体を有効成分とする薬剤、もしくはCCR3
20 が関与する疾患の治療薬もしくは予防薬は、CCR3拮抗剤として、エオタキシンなどのCCR3のリガンドの標的細胞に対する作用を抑制する作用を有する。したがって、これらは気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、接触皮膚炎、およびアレルギー性結膜炎などのアレルギー性疾患、ならびに潰瘍性大腸炎およびクローン病などの炎症性腸疾患など、好酸球、好塩基球、活性化T細胞
25 などの組織への浸潤が病気の進行、維持に主要な役割を演じている疾患に対する治療薬および/または予防薬として有用である。また、CCR3拮抗作用に基づくHIV-1の感染を阻害する作用により、エイズの治療薬および/または治療薬としても有用である。

請求の範囲

1. 下記式 (I) で表される化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容される $C_1 - C_6$ アルキル付加体を有効成分とする、CCR3拮抗
5 作用を有する薬剤。



[式中、 R^1 はフェニル基、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を 1 - 3 個有する芳香族複素環基を表し、上記 R^1 におけるフェニル基または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を 1 - 3 個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成してもよく、さらに上記 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、 $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル基、 $C_2 - C_6$ アルケニル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ基、 $C_3 - C_5$ アルキレン基、 $C_2 - C_4$ アルキレンオキシ基、 $C_1 - C_3$ アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、ベンジルオキシ基、ベンゾイルアミノ基、 $C_2 - C_7$ アルカノイル基、 $C_2 - C_7$ アルコキカルボニル基、 $C_2 - C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 - C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 - C_7$ N -アルキルカルバモイル基、 $C_4 - C_9$ N -シクロアルキルカルバモイル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_3 - C_8$ (アルコキシカルボニル) メチル基、 N -フェニルカルバモイル基、ビペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、1-ピロリジニルカルボニル基、式 : $-\text{NH} (\text{C}=\text{O}) \text{O}-$ で表される 2 価基、式 : $-\text{NH} (\text{C}=\text{S}) \text{O}-$ で表される 30 2 価基、アミノ基、モノ ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基、もしくはジ ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基で置換されていてもよく、これらのフェニル基、 $C_3 - C_8$ シクロ

アルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、C₁—C₆アルキル基、もしくはC₁—C₆アルコキシ基によって置換されていてもよい。

R²は、水素原子、C₁—C₆アルキル基、C₂—C₇アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、またはフェニル基を表し、R²におけるC₁—C₆アルキル基またはフェニル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、C₁—C₆アルキル基、もしくはC₁—C₆アルコキシ基によって置換されていてもよい。ただし、j = 0 のときはR²はヒドロキシ基ではない。

jは0—2の整数を表す。

10 kは0—2の整数を表す。

mは2—4の整数を表す。

nは0または1を表す。

R³は、水素原子、または（それぞれ同一または異なった任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、C₁—C₆アルキル基、もしくはC₁—C₆アルコキシ基によって置換されていてもよい1または2個のフェニル基）によって置換されていてもよいC₁—C₆アルキル基を表す。

R⁴およびR⁵は、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、フェニル基、またはC₁—C₆アルキル基を表し、R⁴およびR⁵におけるC₁—C₆アルキル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、メルカプト基、グアニジノ基、C₃—C₈シクロアルキル基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルキルチオ基、（任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、C₁—C₆アルキル基、C₁—C₆アルコキシ基、もしくはベンジルオキシ基によって置換されていてもよいフェニル基）、フェノキシ基、ベンジルオキシカルボニル基、C₂—C₇アルカノイル基、C₂—C₇アルコキシカルボニル基、C₂—C₇アルカノイルオキシ基、C₂—C₇アルカノイルアミノ基、C₂—C₇N—アルキルカルバモイル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ（C₁—C₆アルキル）アミノ基、ジ（C₁—C₆アルキル）アミノ基、もしくは（ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を1—3個有する芳香族複素環基またはそのベンゼン環との縮合により形成される縮合環）により置換されていてもよく、あるいは、R⁴およびR⁵は、いっしょになって3—6員環状炭化水素を形成していてもよい。

pは0または1を表す。

qは0または1を表す。

Gは、-CO-、-SO₂-、-CO-O-、-NR⁷-CO-、-CO-NR⁷-、-NH-CO-NH-、-NH-CS-NH-、-NR⁷-SO₂-、-SO₂-N

5 R⁷-、-NH-CO-O-、または-O-CO-NH-で表される基を表す。ここで、R⁷は、水素原子またはC₁-C₆アルキル基を表すか、あるいは、R⁷はR⁵といっしょになってC₂-C₅アルキレン基を形成していくてもよい。

10 R⁶は、フェニル基、C₃-C₈シクロアルキル基、C₃-C₆シクロアルケニル基、ベンジル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を1-3個有する芳香族複素環基を表し、上記R⁶におけるフェニル基、ベンジル基、または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／もしくは窒素原子を1-3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成していくてもよく、さらに上記R⁶におけるフェニル基、C₃-C₈シクロアルキル基、C₃-C₆シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、チオシアナト基、カルボキシル基、カルバモイル基、トリフルオロメチル基、C₁-C₆アルキル基、C₃-C₈シクロアルキル基、C₂-C₆アルケニル基、C₁-C₆アルコキシ基、C₃-C₈シクロアルキルオキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₃アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルアミノ基、15 ベンジル基、ベンゾイル基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、3-フェニルウレイド基、C₂-C₇アルカノイル基、C₂-C₇アルコキシカルボニル基、C₂-C₇アルカノイルオキシ基、C₂-C₇アルカノイルアミノ基、C₂-C₇N-アルキルカルバモイル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、フェニルカルバモイル基、N、N-ジ(C₁-C₆アルキル)スルファモイル基、アミノ基、モノ(C₁-C₆アルキル)アミノ基、ジ(C₁-C₆アルキル)アミノ基、ベンジルアミノ基、C₂-C₇(アルコキシカルボニル)アミノ基、C₁-C₆(アルキルスルホニル)アミノ基、もしくは、ビス(C₁-C₆アルキルスルホニル)アミノ基により置換されてもよく、これらのフェニル基、C₃-C₈シクロアルキル基、C₃-C₈シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、C₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、モノ(

C_1-C_6 アルキル)アミノ基、もしくはジ(C_1-C_6 アルキル)アミノ基によって置換されていてもよい。]

2. 上記式(I)において $k=1$ かつ $m=2$ である、請求項1記載のCCR3拮抗作用を有する薬剤。
3. 上記式(I)において $k=0$ かつ $m=3$ である、請求項1記載のCCR3拮抗作用を有する薬剤。
- 10 4. 上記式(I)において $k=1$ かつ $m=3$ である、請求項1記載のCCR3拮抗作用を有する薬剤。
5. 上記式(I)において $k=2$ かつ $m=2$ である、請求項1記載のCCR3拮抗作用を有する薬剤。
- 15 6. 上記式(I)において $k=1$ かつ $m=4$ である、請求項1記載のCCR3拮抗作用を有する薬剤。
7. 上記式(I)で表される化合物、その薬学的に許容される酸付加体、または20 その薬学的に許容される C_1-C_6 アルキル付加体を有効成分とする、CCR3が関与する疾患の治療薬もしくは予防薬。
8. 疾患がアレルギー性疾患である請求項7記載の治療薬もしくは予防薬。
- 25 9. 疾患が気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、接触皮膚炎、またはアレルギー性結膜炎である請求項8記載の治療薬もしくは予防薬。
10. 疾患が炎症性腸疾患である請求項7記載の治療薬もしくは予防薬。
- 30 11. 疾患がエイズである請求項7記載の治療薬もしくは予防薬。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/05260

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
 Int.Cl? A61K31/40, 4025, 445, 4468, 4525, 4535, 454, 422, 404, 4155, 4245, 5377, 4545, 4709, 4184, 427, 506, 433, 423, 4192, 429, 53, A61P37/08, 29/00, 31/18, 11/08, 43/00 // C07D207/14, 211/56, 58, 26, 401/04, 06, 12, 14, 403/06, 12, 405/06, 12, 14, 409/12, 14, 413/06, 14, 417/06, 487/04, 495/06, 04, 513/04
 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl? A61K31/40, 4025, 445, 4468, 4525, 4535, 454, 422, 404, 4155, 4245, 5377, 4545, 4709, 4184, 427, 506, 433, 423, 4192, 429, 53, A61P37/08, 29/00, 31/18, 11/08, 43/00 // C07D207/14, 211/56, 58, 26, 401/04, 06, 12, 14, 403/06, 12, 405/06, 12, 14, 409/12, 14, 413/06, 14, 417/06, 487/04, 495/06, 04, 513/04

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
 REGISTRY (STN), CA (STN), CAOLD (STN), CAPLUS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO, 99/25686, A1 (TEIJIN LIMITED), 27 May, 1999 (27.05.99)	1-10
A	& EP, 1030840, A1 & AU, 9913741, A & NO, 2000002486, A	11
X	EP, 217286, A1 (OKAMOTO SHOSUKE), 08 April, 1987 (08.04.87), Compound No.42	1,5,7-10
A	& JP, 63-022061, A & US, 4895842, A & AU, 8663051, A & CA, 1297633, A	2-4,6,11
X	WO, 98/50534, A1 (SMITHKLINE BEECHAM CORPORATION), 12 November, 1998 (12.11.98)	1,2,5
A	& EP, 991753, A1 & AU, 9872885, A & BR, 9808502, A & ZA, 9803843, A	3,4,6-11
X	GB, 2106108, A (JOHN WYETH AND BROTHER LIMITED), 07 April, 1983 (07.04.83)	1,5
A	& US, 4443461, A	2-4,6-11
X	WO, 97/40051, A1 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.), 30 October, 1997 (30.10.97)	1,5
A		2-4,6-11

Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	
"A"	document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E"	earlier document but published on or after the international filing date
"L"	document which may throw doubt on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O"	document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P"	document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T"	later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X"	document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y"	document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&"	document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search 31 October, 2000 (31.10.00)	Date of mailing of the international search report 07 November, 2000 (07.11.00)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/05260

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
	& JP, 10-226689, A & EP, 915888, A1 & CA, 2251625, A & AU, 9724048, A & ZA, 9703493, A & CN, 1223659, A	
X A	KHALID, M. et al., "N,N'-disubstituted L-isoglutamines as novel cancer chemotherapeutic agents", Drugs Exp. Clin. Res. (1987), Vol.13, Suppl. 1, p.57-60	1,5 2-4,6-11
PX PA	WO, 00/31032, A1 (F.HOFFMANN-LA ROCHE AG), 02 June, 2000 (02.06.00) & DE, 19955794, A & GB, 2343893, A & FR, 2786185, A	1,2,7-11 3-6

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JPOO/05260

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))
 Int. Cl' A61K31/40, 4025, 445, 4468, 4525, 4535, 454, 422, 404, 4155, 4245, 5377, 4545, 4709, 4184, 427, 506, 433, 423, 4192, 429, 53, A61P37/08, 29/00, 31/18, 11/08, 43/00 //, C07D207/14, 211/56, 58, 26, 401/04, 06, 12, 14, 403/06, 12, 405/06, 12, 14, 409/12, 14, 413/06, 14, 417/06, 487/04, 495/06, 04, 513/04

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl' A61K31/40, 4025, 445, 4468, 4525, 4535, 454, 422, 404, 4155, 4245, 5377, 4545, 4709, 4184, 427, 506, 433, 423, 4192, 429, 53, A61P37/08, 29/00, 31/18, 11/08, 43/00 //, C07D207/14, 211/56, 58, 26, 401/04, 06, 12, 14, 403/06, 12, 405/06, 12, 14, 409/12, 14, 413/06, 14, 417/06, 487/04, 495/06, 04, 513/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

REGISTRY (STN), CA (STN), CAOLD (STN), CAPLUS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	WO, 99/25686, A1 (TEIJIN LIMITED) 27.5月. 1999 (27.05.99)	1-10
A	&EP, 1030840, A1 &AU, 9913741, A &NO, 2000002486, A	11
X	EP, 217286, A1 (OKAMOTO SHOSUKE) 8.4月. 1987 (08.04.87)	1, 5, 7-10
A	化合物No. 42参照 &JP, 63-022061, A &US, 4895842, A &AU, 8663051, A &CA, 1297633, A	2-4, 6, 11
X	WO, 98/50534, A1 (SMITHKLINE BEECHAM CORPORATION)	1, 2, 5
A	12.11月. 1998 (12.11.98) &EP, 991753, A1 &AU, 9872885, A &BR, 9808502, A &ZA, 9803843, A	3, 4, 6-11

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日 31. 10. 00	国際調査報告の発送日 07.11.00
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 榎本 佳子 4P 9638 印

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

C (続き) 関連すると認められる文献		関連する 請求の範囲の番号
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	
X A	GB, 2106108, A (JOHN WYETH AND BROTHER LIMITED) 7. 4月. 1983 (07. 04. 83) &US, 4443461, A	1, 5 2-4, 6-11
X A	WO, 97/40051, A1 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) 30. 10月. 1997 (30. 10. 97) &JP, 10-226689, A &EP, 915888, A1 &CA, 2251625, A &AU, 9724048, A &ZA, 9703493, A &CN, 1223659, A	1, 5 2-4, 6-11
X A	KHALID, M. et al., "N,N'-disubstituted L-isoglutamines as novel cancer chemotherapeutic agents", Drugs Exp. Clin. Res. (1987), Vol. 13, Suppl. 1, p. 57-60	1, 5 2-4, 6-11
PX PA	WO, 00/31032, A1 (F. HOFFMANN-LA ROCHE AG) 2. 6月. 2000 (02. 06. 00) &DE, 19955794, A &GB, 2343893, A &FR, 2786185, A	1, 2, 7-11 3-6

THIS PAGE BLANK (USPTO)

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPTO)